

PCT

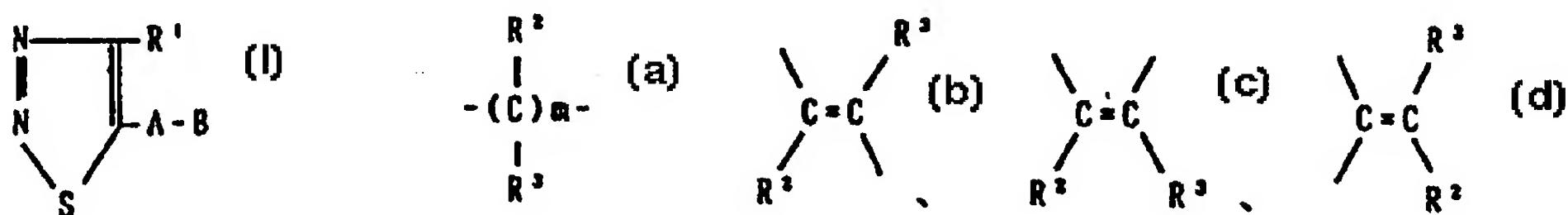
世界知的所有権機関
国際事務局
特許協力条約に基づいて公開された国際出願



(51) 国際特許分類6 C07D 285/06, 417/04, A01N 43/82	A1	(11) 国際公開番号 WO98/14437
		(43) 国際公開日 1998年4月9日(09.04.98)
(21) 国際出願番号 PCT/JP97/03467		
(22) 国際出願日 1997年9月29日(29.09.97)		
(30) 優先権データ 特願平8/278948 1996年9月30日(30.09.96)	JP	(74) 代理人 弁理士 浅村 翔, 外(ASAMURA, Kiyoshi et al.) 〒100 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 新大手町ビル331 Tokyo, (JP)
(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 日本農薬株式会社(NIHON NOHYAKU CO., LTD.)(JP/JP) 〒103 東京都中央区日本橋1丁目2番5号 Tokyo, (JP)		(81) 指定国 AU, CA, CN, KR, RU, US, 欧州特許 (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).
(72) 発明者; および		添付公開書類 国際調査報告書
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 津幡健治(TSUBATA, Kenji)(JP/JP) 〒586 大阪府河内長野市大矢船北町8-9 Osaka, (JP)		
嶋岡孝史(SHIMAOKA, Takashi)(JP/JP) 〒591 大阪府堺市北花田町4丁90-18 Osaka, (JP)		
三瓶 修(SANPEI, Osamu)(JP/JP) 〒586 大阪府河内長野市市町1395-1-205 Osaka, (JP)		
谷山吉隆(TANIYAMA, Yoshitaka)(JP/JP) 〒274 千葉県船橋市葉円台6丁目8-13-101 Chiba, (JP)		
高木和裕(TAKAGI, Kazuhiro)(JP/JP) 〒550 大阪府大阪市西区北堀江4丁目12-10-1124 Osaka, (JP)		

(54) Title: 1,2,3-THIADIAZOLE DERIVATIVES AND SALTS THEREOF, DISEASE CONTROLLING AGENTS FOR AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL USE, AND METHOD FOR THE USE THEREOF

(54) 発明の名称 1,2,3-チアジアゾール誘導体又はその塩類及び農園芸用病害防除剤ならびにその使用方法

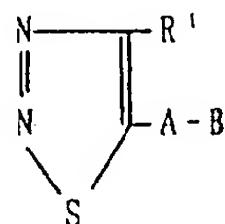


(57) Abstract

1,2,3-Thiadiazole derivatives of general formula (I) and salts thereof, disease controlling agents containing the derivatives or salts as the active ingredients, and a method for the use of the same, wherein R¹ is H, C₁-C₄ (halo)alkyl, a 5- or 6-membered heterocyclic group containing 1 to 3 heteroatoms which may be the same or different from each other and are selected from among O, N and S, or the like; A is (a), (b), (c), (d) (wherein R² and R³ are each H, halogeno, cyano, formyl, alkylthio, alkoxy carbonyl, substituted or unsubstituted phenyl or the like, or alternatively R² and R³ may be united to form a C₂-C₆ alkylene which is optionally interrupted by -O-, -S(O)_n- (wherein n is 0 to 2), -CO- or -NR⁸- (wherein R⁸ is H, halogeno or the like), thus forming a 3- to 7-membered ring); B is cyano, an optionally substituted 5- or 6-membered heterocyclic group containing 1 to 3 heteroatoms selected from among O, N and S, or the like; and m is 0 to 4.

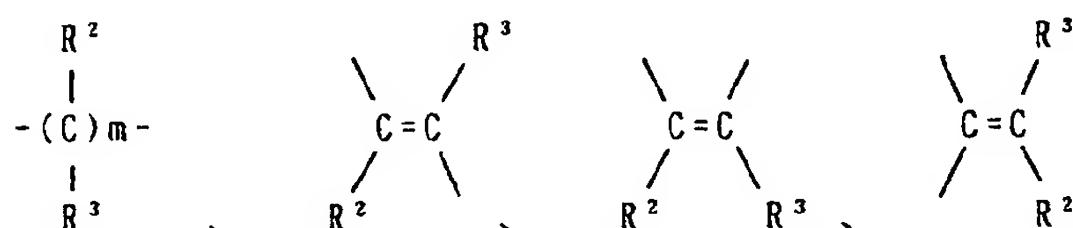
(57) 要約

一般式(I)



(I)

[式中、R¹ はH、(ハロ) C₁-C₄ アルキル、同一又は異なっても良く、1～3個のO、N又はSを有する5～6員ヘテロ環等、Aは



(式中、R²及びR³はH、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アルキルチオ、アルコキカルボニル、置換又は非置換フェニル等、又はR²及びR³は一緒になって-O-、-S(O)n- (nは0～2)、-CO-又は-NR⁸- (R⁸はH、ハロゲン等)で中断されても良いC₂-C₆ アルキレン基により3～7員環を形成することもできる。)、Bはシアノ、又はO、N又はSから選択される1～3個のヘテロ原子を有する置換されてもよい5～6員ヘテロ環等、mは0～4)を示す。]で表される1、2、3一チアジアゾール誘導体又はその塩類、及び該誘導体又はその塩類を有効成分とする農園芸用病害防除剤並びにその使用方法。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に記載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード（参考情報）

AL	アルバニア	ES	スペイン	LK	スリランカ	SE	スウェーデン
AM	アルメニア	FI	フィンランド	LR	リベリア	SG	シンガポール
AT	オーストリア	FR	フランス	LS	レント	SI	スロヴェニア
AU	オーストラリア	GA	ガボン	LT	リトアニア	SK	スロヴァキア共和国
AZ	アゼルバイジャン	GB	英國	LU	ルクセンブルグ	SL	シエラレオネ
BA	ボズニア・エルツェゴビナ	GE	グルジア	LV	ラトヴィア	SN	セネガル
BB	バルバドス	GH	ガーナ	MC	モナコ	SZ	スウェーデン
BE	ベルギー	GM	ガンビア	MD	モルドバ共和国	TD	チャード
BF	ブルキナ・ファン	GN	ギニア	MG	マダガスカル	TG	トーゴ
BG	ブルガリア	GW	ギニアビサウ	MK	マケドニア旧ユーゴス	TJ	タジキスタン
BJ	ベナン	GR	ギリシャ	LA	ラヴィア共和国	TM	トルクメニスタン
BR	ブラジル	HU	ハンガリー	ML	マリ	TR	トルコ
BY	ベラルーシ	ID	インドネシア	MN	モンゴル	TT	トリニダード・トバゴ
CA	カナダ	IE	アイルランド	MR	モーリタニア	UA	ウクライナ
CF	中央アフリカ共和国	IL	イスラエル	MW	マラウイ	UG	ウガンダ
CG	コンゴー	IS	アイスランド	MX	メキシコ	US	米国
CH	スイス	IT	イタリア	NE	ニジェール	UZ	ウズベキスタン
CI	コート・ジボアール	JP	日本	NL	オランダ	VN	ヴィエトナム
CM	カメルーン	KE	ケニア	NO	ノルウェー	YU	ユーゴスラビア
CN	中国	KG	キルギスタン	NZ	ニュージーランド	ZW	ジンバブエ
CU	キューバ	KP	朝鮮民主主義人民共和国	PL	ポーランド		
CZ	チェコ共和国	KR	大韓民国	PT	ポルトガル		
DE	ドイツ	KZ	カザフスタン	RO	ルーマニア		
DK	デンマーク	LC	セントルシア	RU	ロシア連邦		
EE	エストニア	LI	リヒテンシュタイン	SD	スードアン		

明細書

1, 2, 3-チアジアゾール誘導体又はその塩類及び農園芸用病害防除剤ならびにその使用方法

5

発明の属する技術分野

本発明は、1, 2, 3-チアジアゾール誘導体又はその塩類及び該化合物を有効成分として含有する農園芸用病害防除剤並びにその使用方法に関するものである。

10 背景技術

1, 2, 3-チアジアゾール類に関して、特開平2-149579号公報には中枢神経疾患治療剤として、特開昭54-9272号公報、特開平3-181463号公報、同4-234881号公報、カナダ特許第947297号公報等に除草剤又は植物成長調節剤として開示され、WO9501340号公報及び特開平7-252242号公報には殺菌剤として開示されている。

15 発明の開示

本発明者等は新規な農園芸用病害防除剤を創出すべく、鋭意研究を重ねた結果、本発明の一般式(I)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体又はその塩類が文献未記載の新規化合物であり、農園芸用病害防除剤として有用であることを20 見いだし、本発明を完成させたものである。

本発明は一般式(I)



25

[式中、R¹は水素原子、C₁-C₈アルキル基、ハロC₁-C₄アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄アルキル基、ハロC₁-C₄アルキル基、C₁-C₄アルコキシ基、ハロC₁-C₄アルコキシ基又はC₁-C₄アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基

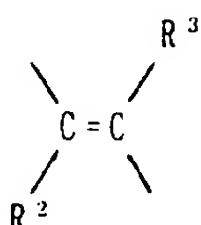
を有する置換フェニル基、同一又は異なっても良く、1～3個の酸素原子、窒素原子又は硫黄原子を有する5～6員ヘテロ環、又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、メルカプト基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、C₁-C₄ アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシル基、カルボキシC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニルC₁-C₄ アルキル基、アミノ基、同一又は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基より選択される置換基を有する置換アミノ基、カルバモイル基、同一又は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基より選択される置換カルバモイル基、カルバモイルC₁-C₄ アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、1～2個のC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基より選択される置換カルバモイルC₁-C₄ アルキル基から選択される1～4個の置換基を有し、同一又は異なっても良く、1～3個の酸素原子、窒素原子、又は硫黄原子を有する置換5～6員ヘテロ環を示し、Aは



(式中、R²及びR³は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ホルミル基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、C₁-C₄ アルキルチオ基、C₁-C₄ アルキルスルフィニル基、C₁-C₄ アルキルスルホニル基、C₁-C₄ アルキルカルボニル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、ハロC₁-C₄ アルコキシ基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニル基、フェニルカルボニル基、又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、C₁-C₄ アルキル基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を環上に有する置換フェニルカルボニル基を示し、R²及びR³は一緒になって-O-、-S(0)n-（式中、nは0～2の整数を示す。）、-CO-又は

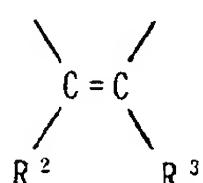
-NR⁸-

(式中、R⁸は水素原子、ホルミル基、C₁-C₈ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、C₂-C₄ アルケニル基、ハロC₂-C₄ アルケニル基、C₂-C₄ アルキニル基、ハロ
5 C₂-C₄ アルキニル基、C₁-C₄ アルキルチオ基、C₁-C₄ アルキルスルフィニル基、C₁-C₄ アルキルスルホニル基、C₁-C₄ アルコキシ
カルボニル基、カルバモイル基、同一又は異なっても良く、C₁-C₄ アルキル基又
はフェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換カルバモイル基、フ
エニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁-C₄
10 アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択
される1～5個の置換基を有する置換フェニル基、フェニルC₁-C₄ アルキル基、
同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁-C₄ アルキル基、
C₁-C₄ アルコキシ基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5
個の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₄ アルキル基、フェニルカルボニル
15 基、又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁
-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から
選択される1～5個の置換基を環上に有する置換フェニルカルボニル基を示す。)
で示される基で中断されても良いC₂-C₆ アルキレン基により3～7員環を形成す
ることもでき、該3～7員環は1以上の同一又は異なっても良いハロゲン原子又
20 はC₁-C₄ アルキル基から選択される置換基を有することもできる。mは0～4の
整数を示す。)、



25

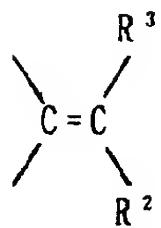
(式中、R²及びR³は前記に同じ。)、



(式中、R²及びR³は前記に同じ。)、

又は

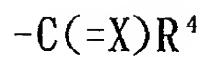
5



(式中、R²及びR³は前記に同じ。)

を示し、BはAの定義中、mが0の場合、シアノ基、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子、又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有す

- 10 る5～6員ヘテロ環、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、メルカプト基、C₁-C₄アルキル基、C₁-C₄アルコキシ基、C₁-C₄アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシル基、カルボキシC₁-C₄アルキル基、C₁-C₄アルコキシカルボニル基、C₁-C₄アルコキシカルボニルC₁-C₄アルキル基、アミノ基、同一又は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄アルキル基又はフェニル基により置換されたアミノ基、カルバモイル基、同一又は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄アルキル基又はフェニル基により置換されたカルバモイル基、カルバモイルC₁-C₄アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、1～2個のC₁-C₄アルキル基又はフェニル基により置換されたカルバモイルC₁-C₄アルキル基から選択される1～4個の置換基を有し、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子、
- 15 又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する置換5～6員ヘテロ環、又は
- 20 又は



- 25 (式中、R⁴は水素原子、C₁-C₈アルキル基、ハロC₁-C₄アルキル基、C₂-C₄アルケニル基、ハロC₂-C₄アルケニル基、C₂-C₄アルキニル基、ハロC₂-C₄アルキニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁-C₄アルキル基、C₁-C₄アルコキシ基、又はC₁-C₄アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニル基、フェニルC₁-C₄

アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁～C₄ アルキル基、C₁～C₄ アルコキシ基、又はC₁～C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニルC₁～C₄ アルキル基、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロ環、又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、メルカプト基、C₁～C₄ アルキル基、C₁～C₄ アルコキシ基、C₁～C₄ アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシル基、カルボキシC₁～C₄ アルキル基、C₁～C₄ アルコキシカルボニル基、C₁～C₄ アルコキシカルボニルC₁～C₄ アルキル基、アミノ基、同一又は異なっても良く、C₁～C₄ アルキル基又は10 フェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換アミノ基、カルバモイル基、同一又は異なっても良く、C₁～C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換カルバモイル基、カルバモイルC₁～C₄ アルキル基、又は同一若しくは異なっても良く、C₁～C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換カルバモイルC₁～C₄ アルキル基から選択される15 される1～4個の置換基を有し、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する置換5～6員ヘテロ環を示す。

XはO、S、

20 N-R⁶

(式中、R⁶は後記に示す。)、

NO-R⁶

(式中、R⁶は後記に示す。)、

25

N(→O)-R⁶

(式中、R⁶は後記に示す。)、

NN(R⁶)R⁷

(式中、R⁶ 及びR⁷ は後記に示す。) 又は



- 5 (式中、R⁶ 及びR⁷ は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、
ホルミル基、C₁-C₄ アルキル基、C₂-C₄ アルケニル基、C₂-C₄ アルキニル基、C₁
-C₄ アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₄ アルキルスルホニル基、C₁-C₂ アルキル
カルボニル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なって
も良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄ アルキル基、ハロ
10 C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、ハロC₁-C₄ アルコキシ基、アミノ基又
はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換
フェニル基、フェニルC₁-C₄ アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原
子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、
C₁-C₄ アルコキシ基、ハロC₁-C₄ アルコキシ基、アミノ基又はC₁-C₄ アルコキシ
15 カルボニル基から選択される1～5個の置換基を環上に有する置換フェニルC₁
-C₄ アルキル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原
子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、
C₁-C₄ アルコキシ基、ハロC₁-C₄ アルコキシ基又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル
基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、カルバ
20 モイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基、フェニル基又は同一若し
くは異なっても良く、ハロゲン原子、C₁-C₄ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、
C₁-C₄ アルコキシ基又はハロC₁-C₄ アルコキシ基から選択される1～5個の置換
基を環上に有する置換フェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換
カルバモイル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原
25 子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、又
はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換
フェニルスルホニル基、チオカルバモイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキ
ル基又はフェニル基により置換されたチオカルバモイル基、C₁-C₄ アルコキ
シカーボンイミドイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基又はフェニ

ル基から選択される置換基を窒素原子上に有するC₁-C₄ アルコキシカーボンイミドイル基、C₁-C₄ アルキルチオカーボンイミドイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を窒素原子上に有するC₁-C₄ アルキルチオカーボンイミドイル基、C₁-C₄ アルキルスルフィニルカーボンイミドイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選
 5 択される置換基を窒素原子上に有するC₁-C₄ アルキルスルフィニルカーボンイミドイル基、C₁-C₄ アルキルスルホニルカーボンイミドイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を窒素原子上に有
 10 するC₁-C₄ アルキルスルホニルカーボンイミドイル基、アミジノ基、同一又は異なっても良く、C₁-C₆ アルキル基又はフェニル基により置換されたアミジノ基、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロ環、又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、メルカプト基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、C₁-C₄ アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシル基、カルボキ
 15 シC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニルC₁-C₄ アルキル基、アミノ基、同一又は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基により置換されたアミノ基、カルバモイル基、同一又
 20 は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基により置換されたカルバモイル基、カルバモイルC₁-C₄ アルキル基、又は同一若しくは異なっても良く、1～2個のC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基により置換されたカルバモ
 イルC₁-C₄ アルキル基から選択される1～4個の置換基を有し、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する置換5～6員ヘテロ環を示し、R⁶ 及びR⁷ は一緒になって-0-、
 -S(O)n- (式中、nは前記に同じ。)、-CO-又は

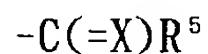
25

-N(R⁸)-(式中、R⁸は前記に同じ、。)

で示される基で中断されても良いC₂-C₆ アルキレン基により3～7員環を形成することもでき、該3～7員環は1以上の同一又は異なっても良いハロゲン原子又

はC₁~C₄ アルキル基から選択される置換基を有することもできる。) を示す。) を示す。

mが1以上の場合、Bは水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、同一又は異なっても良い、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1~3個のヘテロ原子を有する5~6員ヘテロ環、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、メルカプト基、C₁~C₄ アルキル基、C₁~C₄ アルコキシ基、C₁~C₄ アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシル基、カルボキシC₁~C₄ アルキル基、C₁~C₄ アルコキシカルボニル基、C₁~C₄ アルコキシカルボニルC₁~C₄ アルキル基、アミノ基、カルバモイル基、同一又は異なっても良い1~2個のC₁~C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を有する置換カルバモイル基、カルバモイルC₁~C₄ アルキル基、又は同一若しくは異なっても良い1~2個のC₁~C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を有する置換カルバモイルC₁~C₄ アルキル基から選択される1~3個の置換基を有し、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1~3個のヘテロ原子を有する置換5~6員ヘテロ環、



(式中、Xは前記に同じくし、R⁵は水素原子、C₁~C₈ アルキル基、ハロC₁~C₄ アルキル基、C₂~C₄ アルケニル基、ハロC₂~C₄ アルケニル基、C₂~C₄ アルキニル基、ハロC₂~C₄ アルキニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁~C₄ アルキル基、C₁~C₄ アルコキシ基又はC₁~C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1~5個の置換基を有する置換フェニル基、フェニルC₁~C₄ アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁~C₄ アルキル基、C₁~C₄ アルコキシ基又はC₁~C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1~5個の置換基を環上に有する置換フェニルC₁~C₄ アルキル基、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1~3個のヘテロ原子を有する5~6員ヘテロ環、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、メルカプト基、C₁~C₄ アルキル基、

C_1-C_4 アルコキシ基、 C_1-C_4 アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシル基、カルボキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_4 アルコキシカルボニル C_1-C_4 アルキル基、アミノ基、同一又は異なっても良く、 C_1-C_4 アルキル基又はフェニル基から選択される 1 ~ 2 個の置換基を有する置換アミノ基、
 5 カルバモイル基、同一又は異なっても良く、 C_1-C_4 アルキル基又はフェニル基から選択される 1 ~ 2 個の置換基を有する置換カルバモイル基、カルバモイル C_1-C_4 アルキル基、又は同一若しくは異なっても良く、 C_1-C_4 アルキル基又はフェニル基から選択される 1 ~ 2 個の置換基を有する置換カルバモイル C_1-C_4 アルキル基から選択される 1 ~ 4 個の置換基を有し、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する置換 5 ~ 6 員ヘテロ環、
 10

$O-R^6$

(式中、 R^6 は前記に同じ。)、

15

$S(O)n-R^6$

(式中、n 及び R^6 は前記に同じ。) 又は

$N(R^6)R^7$

20 (式中、 R^6 及び R^7 は前記に同じ。) を示す。)、



25 (式中、 R^5 は前記に同じくし、 R^9 及び R^{10} は同一又と異なっても良く、ホルミル基、 C_1-C_4 アルキルカルボニル基、 C_1-C_4 アルコキシカルボニル基、フェニルカルボニル基、又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、 C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ基、又は C_1-C_4 アルコキシカルボニル基から選択される 1 ~ 5 個の置換基を環上に有する置換フェニルカルボニル

基を示し、R⁹ 及びR¹⁰が一緒にあって-O-、-S(O)n-（式中、nは前記に同じ。）、-CO-又は

-N(R⁸)-

5 (式中、R⁸は前記に同じ。。)

で示される基で中断されても良いC₂-C₆ アルキレン基により3～7員環を形成することもでき、該3～7員環は1以上の同一又は異なっても良いハロゲン原子又はC₁-C₄ アルキル基から選択される置換基を有することもできる。）、

10 O-R⁶

(式中、R⁶は前記に同じ。)、

S(O)n-R⁶

(式中、R⁶及びnは前記に同じ。)、

15

N(R⁶)R⁷

(式中、R⁶及びR⁷は前記に同じ。)、

N=C(R⁶)R⁷

20 (式中、R⁶及びR⁷は前記に同じ。)又は

ON=C(R⁶)R⁷

(式中、R⁶及びR⁷は前記に同じ。)

を示す。]

25 で表される1，2，3-チアジアゾール誘導体又はその塩類及び該化合物を有効成分として含有する農園芸用病害防除剤並びにその使用方法に関するものである。
発明を実施するための最良の形態

本発明の一般式(I)で表される1，2，3-チアジアゾール誘導体における各置換基の定義中、『ハロゲン原子』とは塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又はフ

- ッ素原子を示し、『C₁-C₈ アルキル基』とは、炭素原子数1～8の直鎖状又は分枝状のアルキル基を示し、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル、n-ヘプチル、n-オクチル等のアルキル基を示し、『ハロC₁-C₄ アルキル基』とは同一又は異なっても良く、1以上のハロゲン原子で置換された炭素原子数1～4の直鎖状又は分枝状のアルキル基を示し、『C₂-C₄ アルケニル基』とは2重結合を有する炭素原子数2～4の直鎖状又は分枝状のアルケニル基を示し、『ハロ C₂-C₄ アルケニル基』とは同一又は異なっても良く、1以上のハロゲン原子で置換された炭素原子数2～4の直鎖状又は分枝状のアルケニル基を示す。
- 10 『C₂-C₄ アルキニル基』とは3重結合を有する炭素原子数2～4の直鎖状又は分枝状のアルキニル基を示し、『ハロ C₂-C₄ アルキニル基』とは同一又は異なっても良く、1以上のハロゲン原子で置換された炭素原子数2～4の直鎖状又は分枝状のアルキニル基を示し、『同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1以上のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロ環』とは、
- 15 例えればフラン、チオフェン、ピロール、オキサゾール、チアゾール、イソチアゾール、ピラゾール、イミダゾール、1, 2, 3-チアジアゾール、1, 2, 4-チアジアゾール、1, 2, 5-チアジアゾール、1, 3, 4-チアジアゾール、1, 2, 4-トリアゾール、ピリジン、ピリダジン、ピリミジン、ピラジン、ピロリジン、ピペリジン、モルホリン、チオモルホリン、ジチオラン、ジチアン、
- 20 ピペラジン、ジオキソラン又とイミダゾリジン等の5～6員複素環を示すものとする。

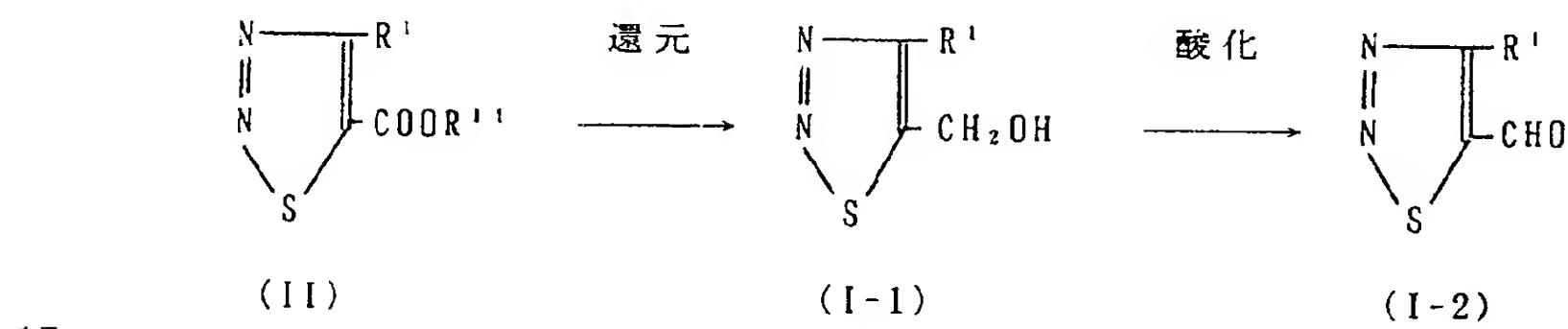
一般式(I)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体の塩類としては、例えればナトリウム、カリウム等のアルカリ金属塩、カルシウム、マグネシウム等のアルカリ土類金属塩、アンモニウム塩、同一又は異なっても良く1以上のC₁-C₁₂アルキル基、フェニル基、置換フェニル基、ベンジル基、又は置換ベンジル基により置換されたアンモニウム塩、グアジニウム塩等を例示することができる。

本発明の好ましい置換基としては、R¹はメチル、エチル、n-プロピル、シクロプロピル等の置換基が、Aは単結合（Bが直接チアジアゾール環に置換）又はメチレンが、Aが単結合の場合、Bはシアノ、ホルミル、ヒドロキシイミノメチ

ル、ベンジルオキシイミノメチル、ヒドラゾノメチル、フェニルヒドラゾノメチル、イミダゾリン-2-イル、4-メチルチアゾール-2-イル等の置換基が、Aがメチレンの場合、Bはクロロ原子、ヒドロキシ基、メトキシ基、ベンジルオキシ基、アセトキシ基、ベンゾイルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、アミノ基及びその塩酸塩、ジエチルアミノ基、ジプロペニルアミノ基、ベンゾイルアミノ基、p-トルエンスルホニルアミノ基、3-フェニルウレイド基、4-メチル-1、2、3-チアジアゾール-5-イルメトキシ基等の置換基が好ましい。

本発明の一般式(I)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体又はその塩類は、例えば下記に例示する製造方法により製造することができる。

10 製造方法 1



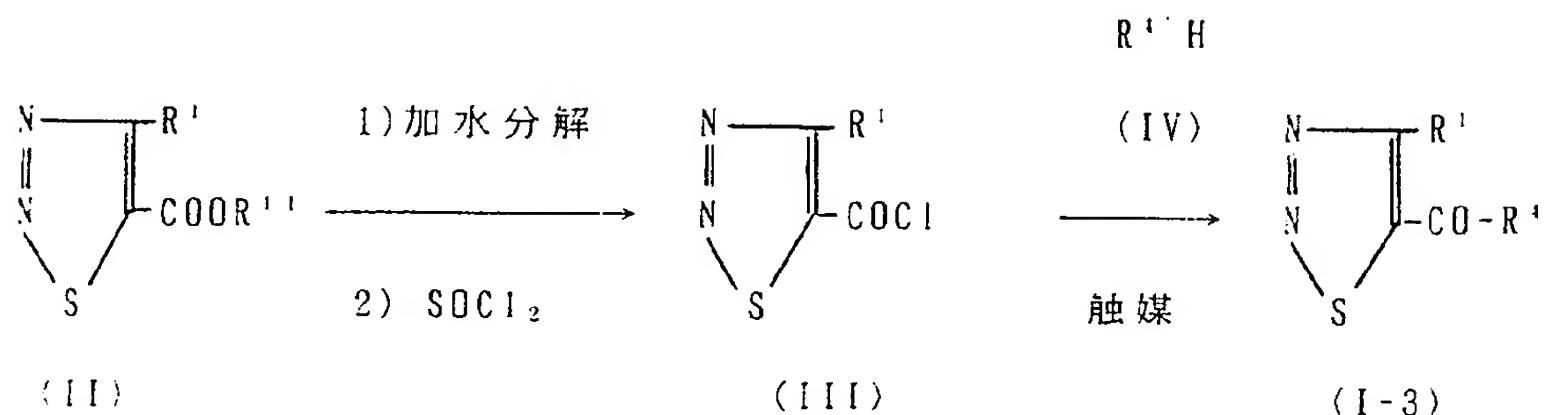
(式由 R^1 は前記に同じくし、 R^{11} は C_1-C_6 アルキル基を示す。)

一般式(II)で表される化合物を還元剤の存在下に還元反応を行い、一般式(I-1)で表される 1, 2, 3-チアジアゾール誘導体とし、該誘導体(I-1)を単離し、又は単離せずして酸化剤の存在下に酸化反応を行うことにより一般式(I-1)で表される 1, 2, 3-チアジアゾール誘導体を製造することができる。

本反応は『新実験化学講座』、15巻(II)、191頁(丸善株)、『実験化学講座(第4版)』、23巻(V)、43頁(丸善株)等に記載の方法に準じて製造することができる。

製造方法 2

25

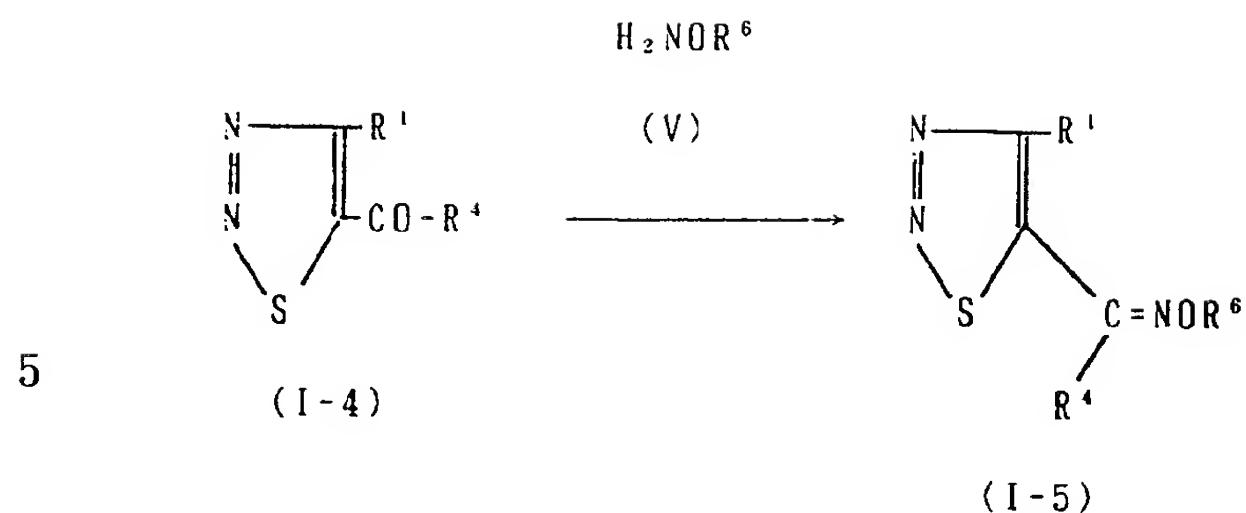


(式中、R¹ 及びR¹¹は前記に同じくし、R⁴ はフェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニル基、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロ環、又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、メルカプト基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、C₁-C₄ アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシル基、カルボキシC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニルC₁-C₄ アルキル基、アミノ基、同一又は異なっても良く、C₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換アミノ基、カルバモイル基、同一又は異なっても良く、C₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換カルバモイル基、カルバモイルC₁-C₄ アルキル基、又は同一若しくは異なっても良く、C₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換カルバモイルC₁-C₄ アルキル基から選択される1～4個の置換基を有する同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する置換5～6員ヘテロ環を示す。)

一般式(II)で表される化合物を加水分解し、次いで塩化チオニルと反応させることにより、一般式(III) で表される化合物とし、該化合物(III) を単離し、又は単離せずして一般式(IV)で表される化合物と触媒の存在下に反応させることにより、一般式(I-3) で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体を製造することができる。

本反応は『新実験化学講座』14巻(II)、794頁に記載の方法に準じて製造することができる。

25 製造方法 3

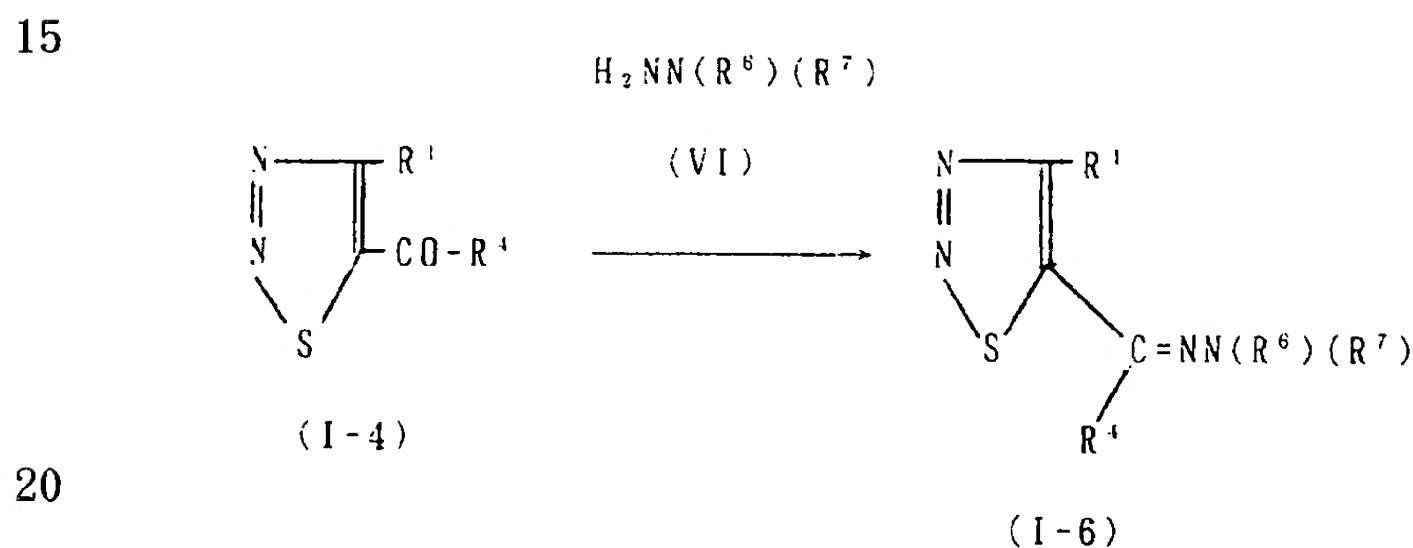


(式中、 R^1 及び R^4 及び R^6 は前記に同じ。)

一般式(I-4) で表される 1, 2, 3 -チアジアゾール誘導体と一般式(V) で表
10 される化合物を反応させることにより、一般式(I-5) で表される 1, 2, 3 -チ
アジアゾール誘導体を製造することができる。

本反応は『実験化学講座（第4版）』、20巻（V）、353頁に記載の方法に準じて製造することができる。

製造方法 4

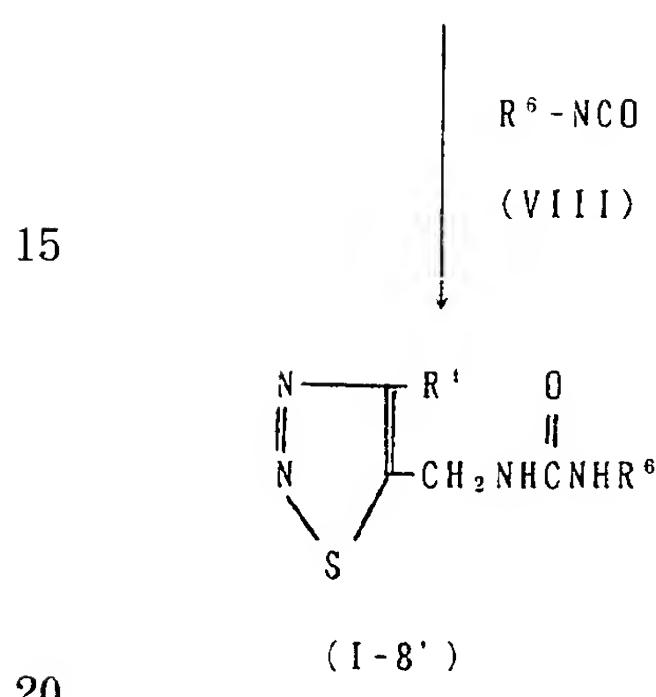
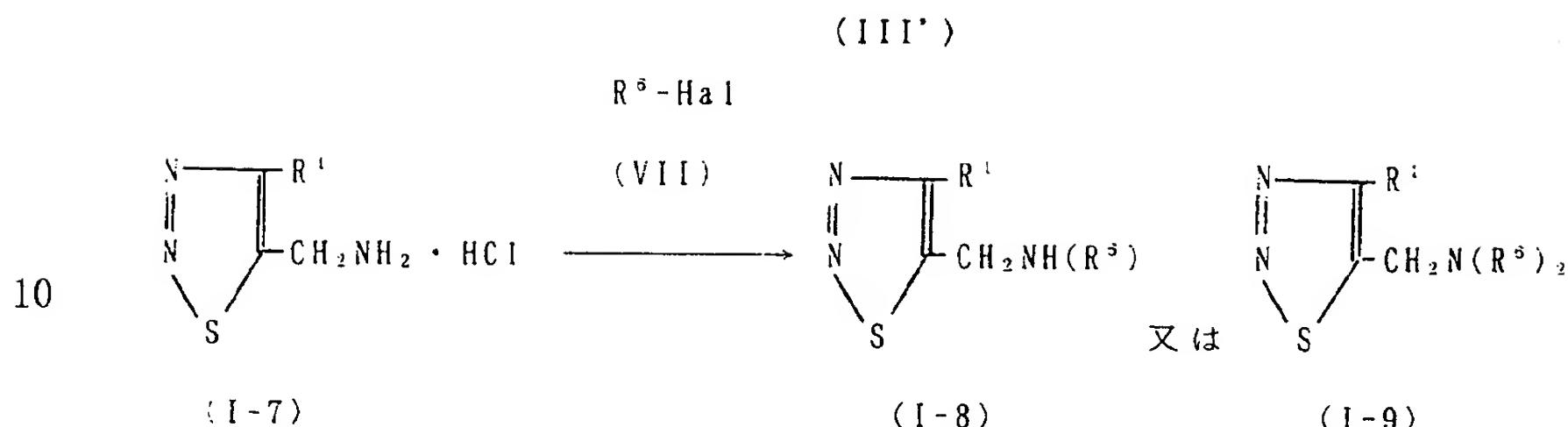
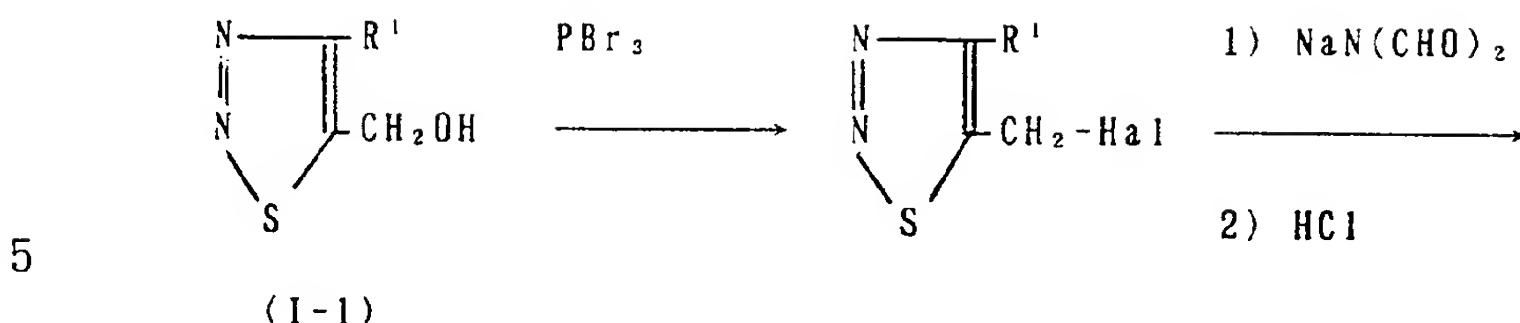


(式中、 R^1 及び R^4 、 R^6 及び R^7 は前記に同じ。)

一般式(I-4)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体と一般式(VI)で表される化合物を反応させることにより、一般式(I-6)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体を製造することができる。

本反応はOrg. Synth., Coll. VI, p12 (1988) に記載の方法に準じて製造することができる。

製造方法 5

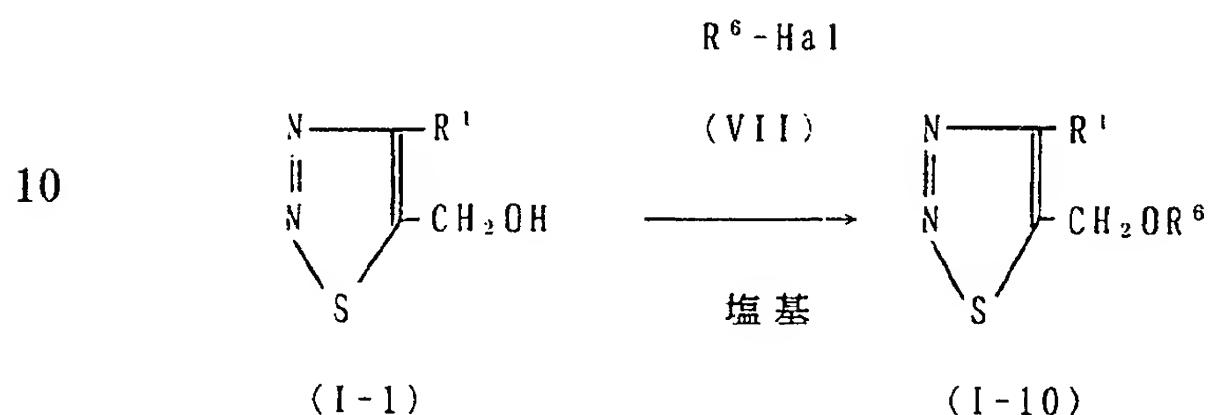
SOCI₂ 又は(式中、R¹ 及びR⁶ は前記に同じくし、Hal はハロゲン原子を示す。)

一般式(I-1)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体と塩化チオニル又は三臭化リン等のハロゲン化剤でハロゲン化反応を行い、一般式(III')で表される化合物とし、該化合物(III')を単離し、又は単離せずしてホルムイミドナトリウムと反応させ、次いで塩酸等の酸と反応させることにより、一般式(I-7)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体の塩とし、該塩(I-7)を一般式(VII)と反応させることにより、一般式(I-8)又は一般式(I-9)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体を製造することができる。又、一般式(I-7)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体の塩と一般式(VIII)で表されるイソシアネー

ト類とを反応させることにより、一般式(I-8')で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体を製造することができる。

本反応は『実験化学講座（第4版）』、19巻（I）、438頁、
Synthesis, 615 (1990)、『実験化学講座（第4版）』、22
5巻（II）、1142頁、『新実験化学講座』、14巻（III）、1631頁
等に記載の方法に準じて製造することができる。

製造方法 6

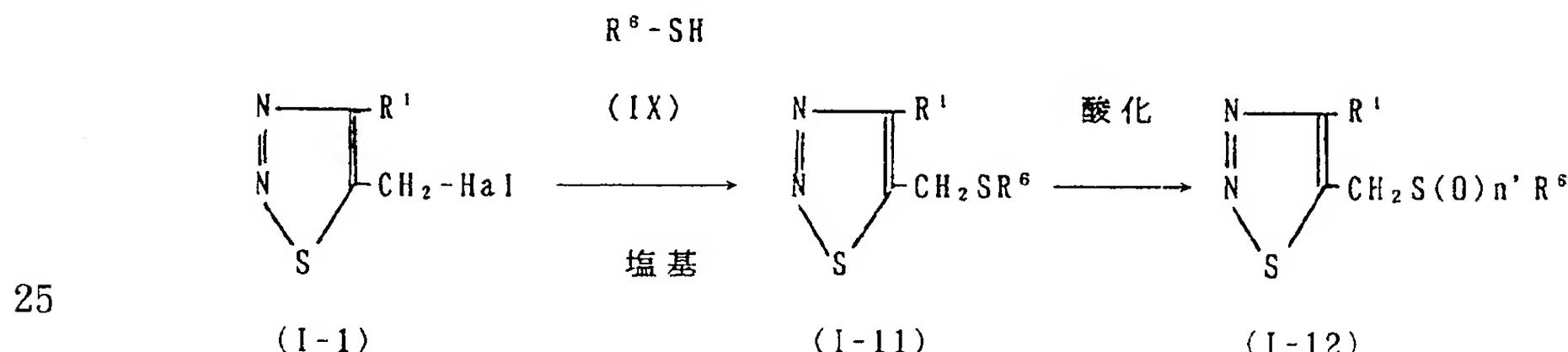


(式中、 R^1 、 R^6 及び Hal は前記に同じ。)

15 一般式(I-1)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体と一般式(VII)で表される化合物とを塩基の存在下に反応させることにより、一般式(I-10)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体を製造することができる。

本反応は『実験化学講座（第4版）』、22巻（V）、50頁等に記載の方法に準じて製造することができる。

20 製造方法 7



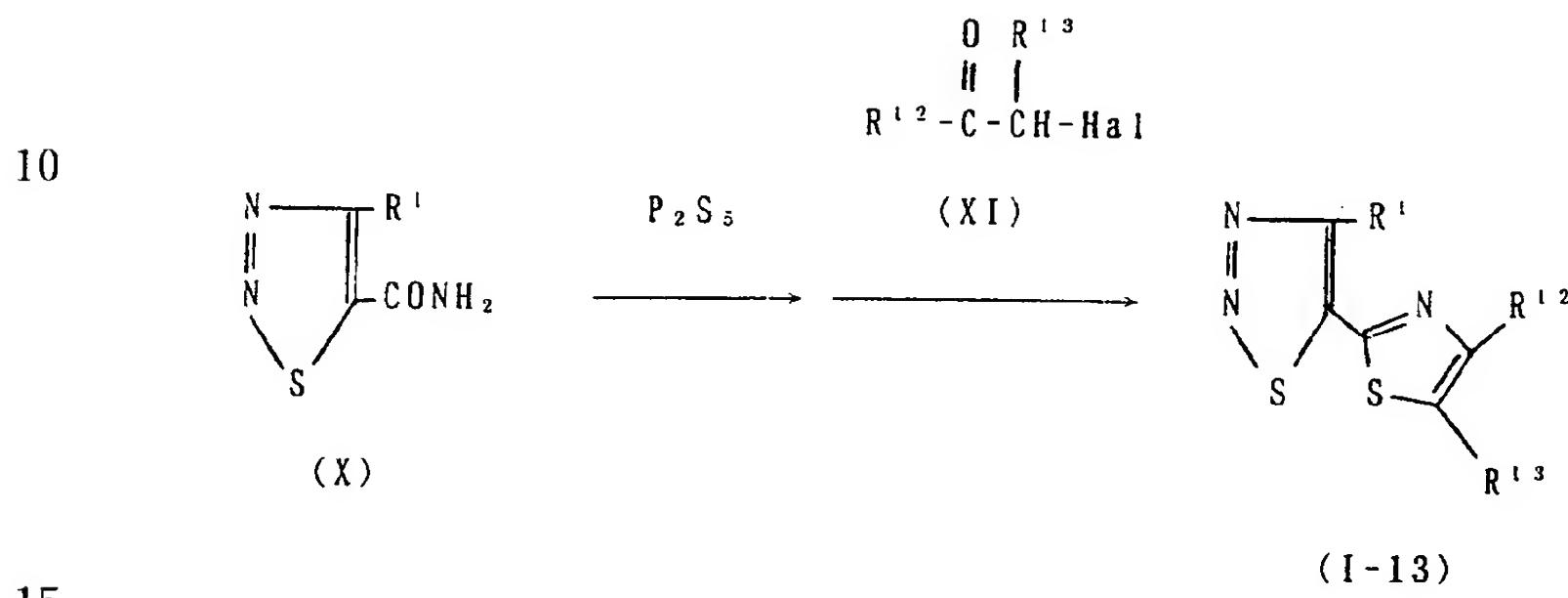
(式中、 R^1 、 R^6 及び $Ha1$ は前記に同じくし、 n' は $1 \sim 2$ の整数を示す。)

一般式(I-1)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体と一般式(IX)で表される化合物とを塩基の存在下に反応させることにより、一般式(I-11)で表され

る 1, 2, 3-チアジアゾール誘導体とし、該誘導体(I-11)を単離し、又は単離せずして酸化剤の存在下に酸化反応を行うことにより、一般式(I-12)で表される 1, 2, 3-チアジアゾール誘導体を製造することができる。

本反応は『新実験化学講座』、14巻(III)、1716頁、『実験化学講
5 座(第4版)』、24巻(VI)、365頁等に記載の方法に準じて製造するこ
とができる。

製造方法 8



15

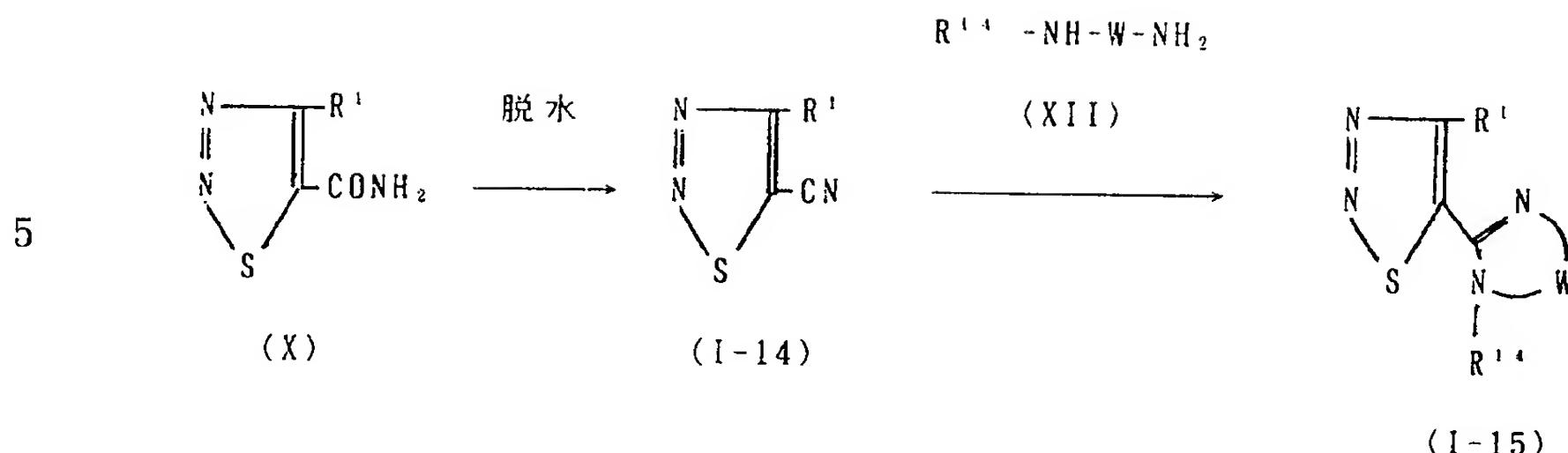
(式中、R¹ 及び Hal は前記に同じくし、R¹² 及び R¹³ は同一又は異なっても
良く、C₁-C₄ アルキル基、カルボキシル基、カルボキシC₁-C₄ アルキル基、C₁
-C₄ アルコキカルボニル基、C₁-C₄ アルコキカルボニルC₁-C₄ アルキル基、
カルバモイル基、同一又は異なっても良く、C₁-C₄ アルキル基又はフェニル基か
ら選択される 1 ~ 2 個の置換基を有するカルバモイル基、カルバモイルC₁-C₄ ア
ルキル基、又は同一若しくは異なっても良く、C₁-C₄ アルキル基又はフェニル基
から選択される 1 ~ 2 個の置換基を有するカルバモイルC₁-C₄ アルキル基を
示す。)

一般式(X) で表される化合物を五硫化リンと反応させ、次いで一般式(XI)で表
25 される化合物と反応させることにより、一般式(I-13)で表される 1, 2, 3-チ
アジアゾール誘導体を製造することができる。

本反応は『新実験化学講座』、14巻(IV)、2198頁、Org.

Synth., Coll. Vol. III, p 332 (1955) 等に記載の方
法に準じて製造することができる。

製造方法 9



(式中、 R^1 は前記に同じくし、 R^{14} は水素原子又は C_1-C_4 アルキル基を示し、
10 W は C_1-C_4 アルキル基で置換されても良く、 $-O-$ 、

$-NR^6-$

(式中、 R^6 は前記に同じ。)、

15

$-S(O)n-$

(式中、 n は前記に同じ。)、又は

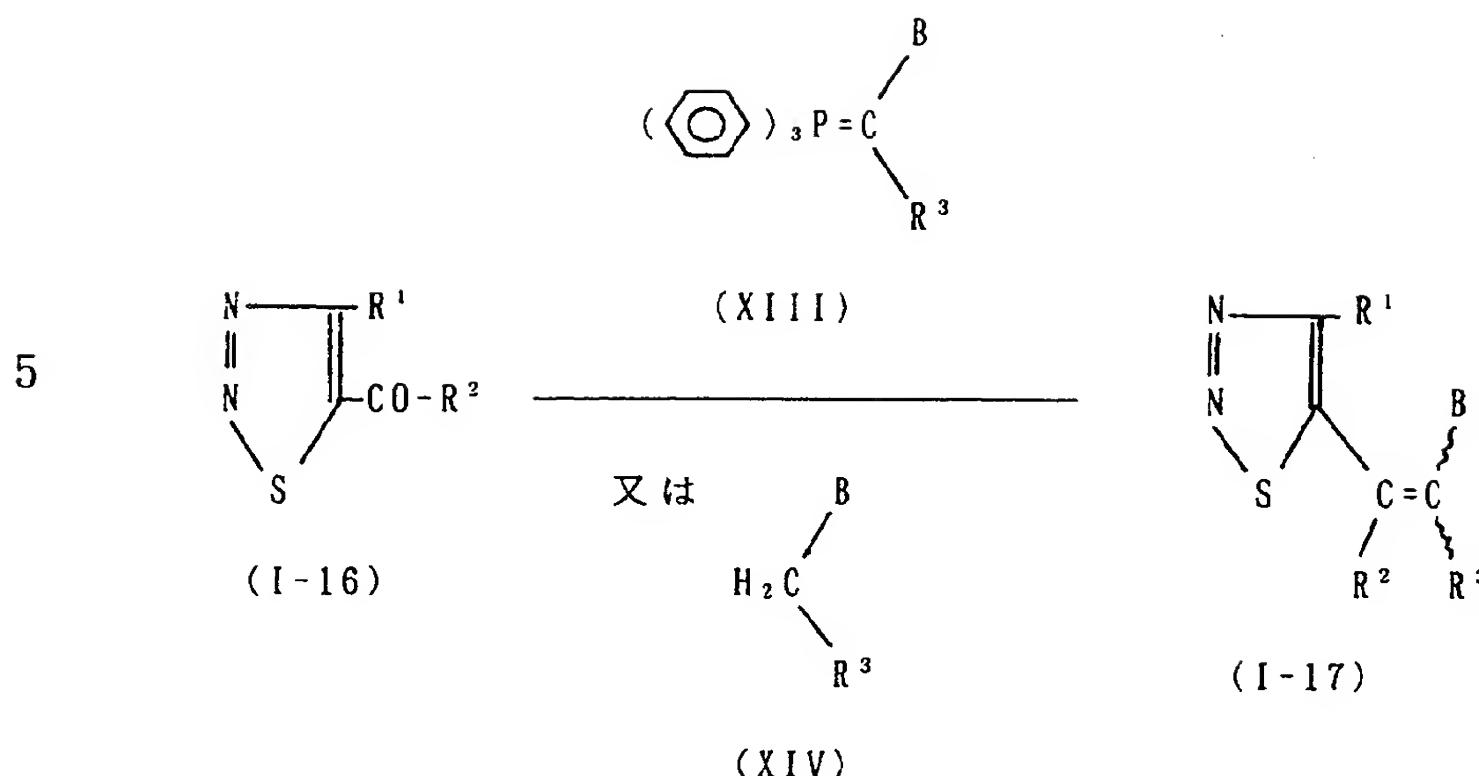
$-CO-$

20 で中断されても良い C_3-C_6 アルキレン基を示す。)

一般式(X) で表される化合物を脱水反応させ、一般式(I-14)で表される 1, 2,
3-チアジアゾール誘導体とし、該誘導体(I-14)を単離し、又は単離せずして一
般式(XII) で表される化合物と反応させることにより、一般式(I-15)で表される
1, 2, 3-チアジアゾール誘導体を製造することができる。

25 本反応は『新実験化学講座』、14巻 (II)、1190頁等に記載の方法に
準じて製造することができる。

製造方法 10



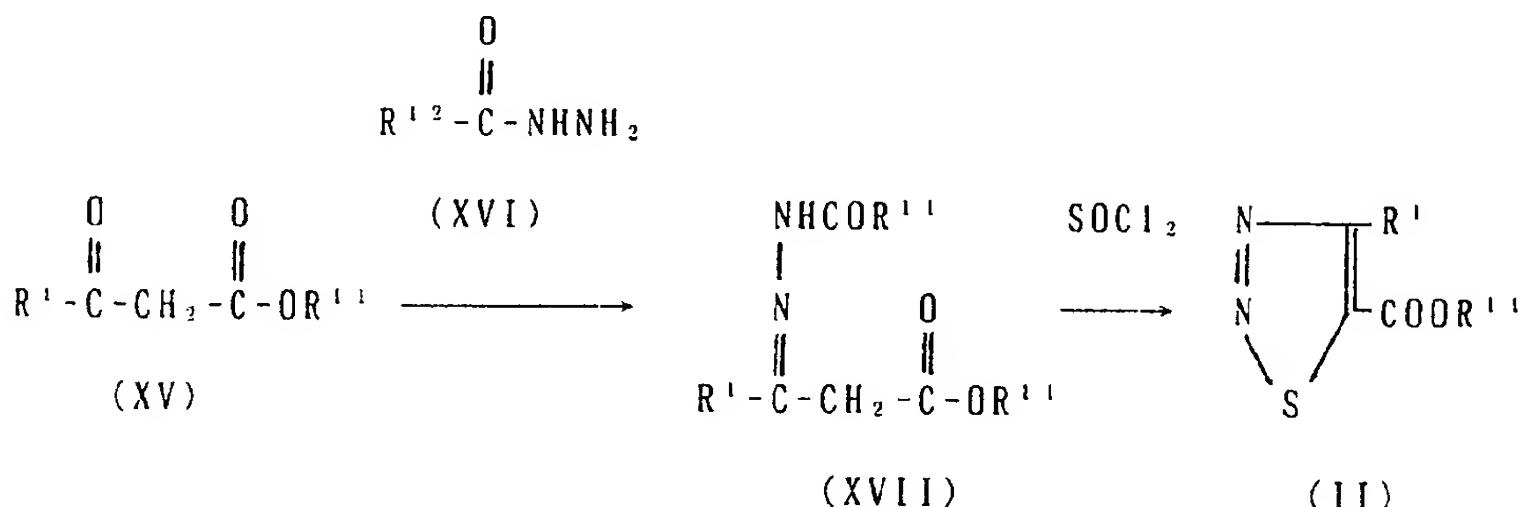
10 (式中、R¹、R²、R³ 及びBは前記に同じ。)

一般式(I-16)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体を一般式(XIII)で表される化合物又は一般式(XIV)で表される化合物と反応させることにより、一般式(I-17)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体を製造することができる。

15 本反応は『新実験化学講座』、14巻(I)、224頁、特開平7-165757号公報等に記載の方法に準じて製造することができる。

本発明の一般式(I)で表される1, 2, 3-チアジアジン誘導体を製造する際の原料化合物である一般式(II)で表される化合物は、例えば以下の製法により製造することができる。

20



25

(式中、R¹は前記に同じくし、R¹¹はC₁-C₈アルキル基を示し、R¹²はC₁-C₄アルキル基、C₁-C₄アルコキシ基、又は置換基を有しても良いアミノ基を示す。)

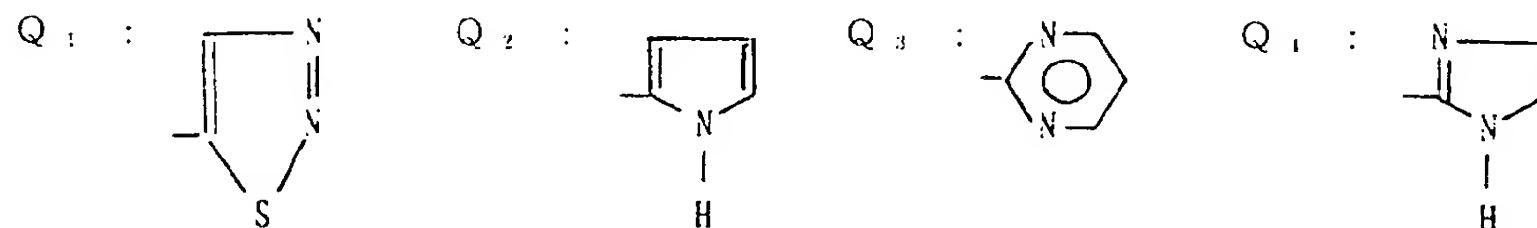
一般式(XV)で表される化合物と一般式(XVI)で表される化合物を反応させ、一般式(XVII)で表される化合物とし、該化合物(XVII)を単離し、又は単離せずして塩化チオニルで閉環反応を行うことにより、一般式(II)で表される化合物を製造することができる。

5 本反応はJ. Am. Chem. Soc., 77, 5359 (1955) 等に記載の公知の方法により製造することができる。

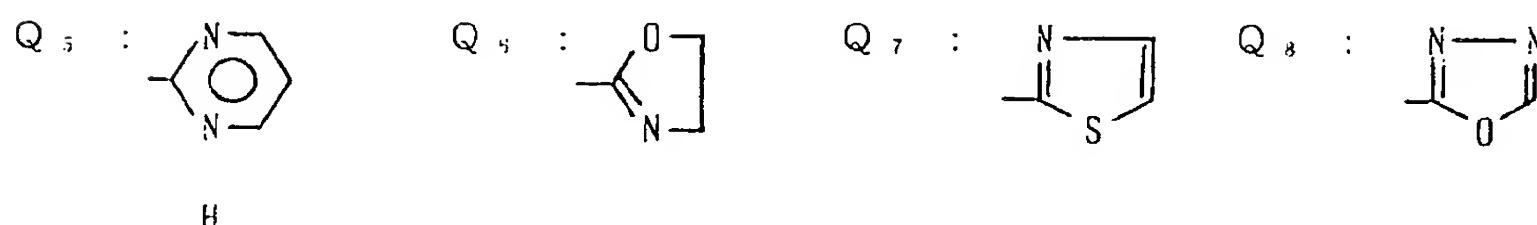
以下に本発明の一般式(I)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体の代表例を例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、第1表中の略号は以下の基を示すものとする。

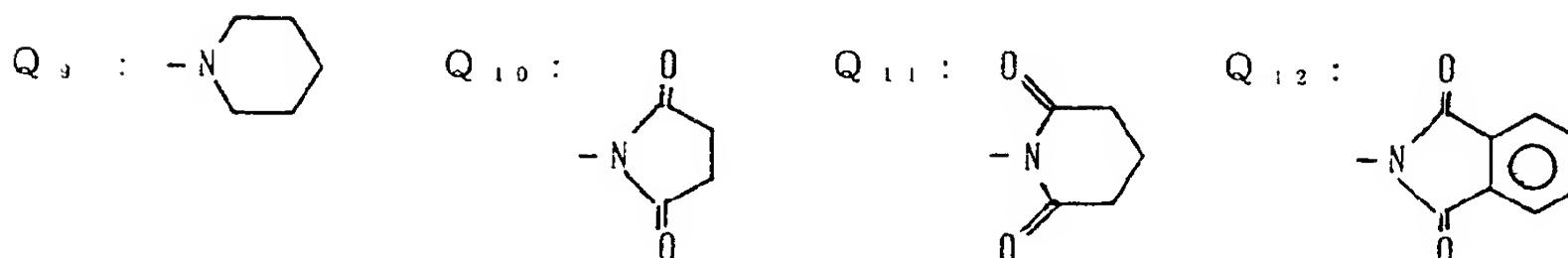
10 Ph : フェニル基 cyclo : 脂環式炭化水素

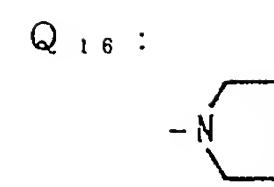
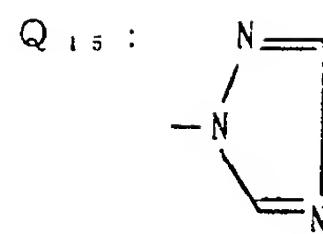
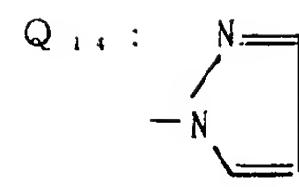
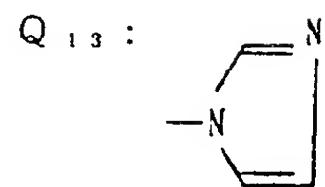


15

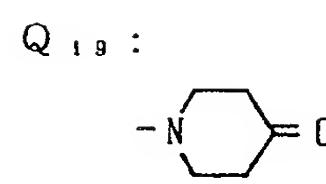
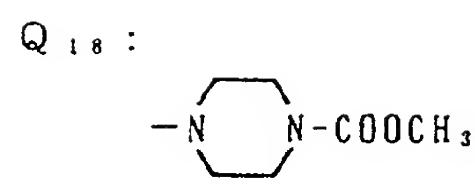
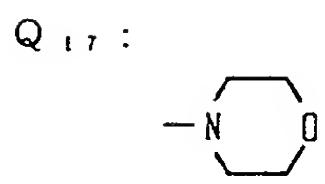


20

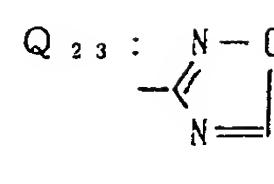
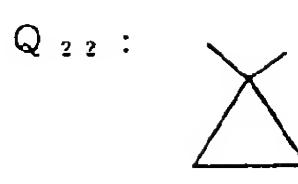
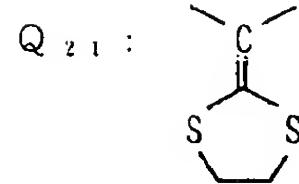
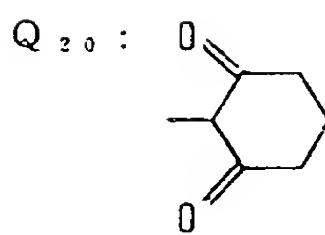




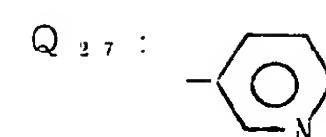
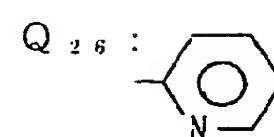
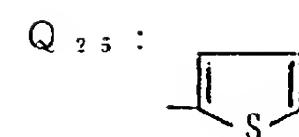
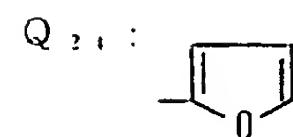
5



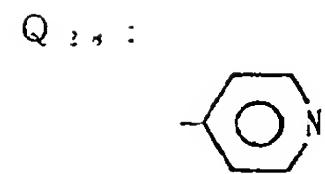
10



15

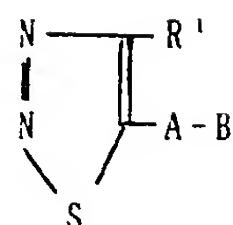


20



一般式(I)

25



(I)

第1表

No	R ¹	A	B	物性
1	H	—	COPh	m. p. 60-61 °C
2	H	CH ₂	Cl	
3	H	CH ₂	OH	
4	H	CH ₂	OCH ₃	
5	H	CH ₂	OCH ₂ Ph	

第1表(続き)

No	R ¹	A	B	物性
6	H	CH ₂	OCH ₂ -Q ₁	
7	CH ₃	—	CHO	nD 1.5555(26°C)
8	CH ₃	—	COCH ₃	
9	CH ₃	—	COPh	nD 1.6145(22°C)
10	CH ₃	—	CO(2-Cl-Ph)	
11	CH ₃	—	CO(4-Cl-Ph)	
12	CH ₃	—	CO(2-CH ₃ -Ph)	
13	CH ₃	—	CO(4-CH ₃ -Ph)	
14	CH ₃	—	CO(4-i-C ₃ H ₇ -Ph)	
15	CH ₃	—	CO(4-CH ₃ O-Ph)	
16	CH ₃	—	CO(4-t-C ₄ H ₉ -Ph)	
17	CH ₃	—	CO-(1-CH ₃ -Q ₂)	m. p. 85-90 °C
18	CH ₃	—	CN	m. p. 50.4°C
19	CH ₃	—	CH=NOH	m. p. 270 °C(dec.)
20	CH ₃	—	CH=NOCH ₃	m. p. 97°C
21	CH ₃	—	CH=NOCH ₂ Ph	nD 1.5998(25°C)
22	CH ₃	—	CH=NOCH ₂ (2-Cl-Ph)	
23	CH ₃	—	CH=NOCH ₂ (3-Cl-Ph)	
24	CH ₃	—	CH=NOCH ₂ (4-Cl-Ph)	m. p. 70-80 °C
25	CH ₃	—	CH=NOCH ₂ (2-CH ₃ -Ph)	
26	CH ₃	—	CH=NOCH ₂ (3-CH ₃ -Ph)	
27	CH ₃	—	CH=NOCH ₂ (4-CF ₃ -Ph)	

第1表 (続き)

No	R ¹	A	B	物性
28	CH ₃	—	CH=NOCH ₂ (4-OH-Ph)	
29	CH ₃	—	CH=NOCH ₂ (4-CH ₃ O-Ph)	
30	CH ₃	—	CH=NOCH ₂ (4-CF ₃ O-Ph)	
31	CH ₃	—	CH=NOCH ₂ (4-NH ₂ -Ph)	
32	CH ₃	—	CH=NOCH ₂ (4-NO ₂ -Ph)	
33	CH ₃	—	CH=NOCH ₂ (4-CN-Ph)	
34	CH ₃	—	CH=NOCH ₂ (4-COOCH ₃ -Ph)	
35	CH ₃	—	CH=NNH ₂	m. p. 81°C
36	CH ₃	—	CH=NNHCH ₃	
37	CH ₃	—	CH=NNHPh	m. p. 218 °C
38	CH ₃	—	CH=NNH(2-C1-Ph)	
39	CH ₃	—	CH=NNH(2-F-4-C1-Ph)	
40	CH ₃	—	CH=NNH(3,5-C1 ₂ -Ph)	
41	CH ₃	—	CH=NNH(3-C1-Ph)	
42	CH ₃	—	CH=NNH(3-i-C ₃ H ₇ O-Ph)	
43	CH ₃	—	CH=NNH(4-CF ₃ -Ph)	
44	CH ₃	—	CH=NNH(4-Cl-Ph)	
45	CH ₃	—	CH=NNHC ₂ OOCCH ₃	
46	CH ₃	—	CH=NNHC ₂ OOC ₄ H ₉ -t	
47	CH ₃	—	CH=NNHCONHCH ₃	
48	CH ₃	—	CH=NNHCONHC ₂ H ₅	
49	CH ₃	—	CH=NNHCON(CH ₃)Ph	

第1表（続き）

No	R ¹	A	B	物性
50	CH ₃	—	CH=NNHCONH(4-Cl-Ph)	
51	CH ₃	—	CH=NNHCONH(4-t-C ₄ H ₉ -Ph)	
52	CH ₃	—	CH=NNHCONH(4-CF ₃ -Ph)	
53	CH ₃	—	CH=NNHCONH(4-i-C ₃ H ₇ O-Ph)	
54	CH ₃	—	CH=NNHCONH(4-CF ₃ O-Ph)	
55	CH ₃	—	CH=NNHCSNHCH ₃	
56	CH ₃	—	CH=NNHC(N(CH ₃) ₂)=NCH ₃	
57	CH ₃	—	CH=NNHC(OCH ₃)=NCH ₃	
58	CH ₃	—	CH=NNHC(SCH ₃)=NCH ₃	
59	CH ₃	—	CH=NNHC(SOCH ₃)=NCH ₃	
60	CH ₃	—	CH=NNH-(4, 6-(CH ₃) ₂ -Q ₃)	m. p. 182-183 °C
61	CH ₃	—	C(Ph)=NOH	m. p. 172 °C
62	CH ₃	—	C(Ph)=NOCH ₃	nD 1.5905(22.8°C)
63	CH ₃	—	C(Ph)=NOC ₈ H ₁₇	
64	CH ₃	—	C(Ph)=NOCH ₂ CH=CH ₂	
65	CH ₃	—	C(Ph)=NOCH ₂ CCl=CH ₂	
66	CH ₃	—	C(Ph)=NOCH ₂ C≡CH	nD 1.5945(22.8°C)
67	CH ₃	—	C(Ph)=NOCH ₂ C≡CBr	
68	CH ₃	—	C(Ph)=NOCH ₂ C≡CCl	
69	CH ₃	—	C(Ph)=NOCH ₂ Ph	nD 1.6183(23.9°C)
70	CH ₃	—	C(Ph)=NOCH ₂ (4-Cl-Ph)	
71	CH ₃	—	C(Ph)=NOCH ₂ (3, 4-Cl ₂ -Ph)	

第1表 (続き)

No	R ¹	A	B	物性
72	CH ₃	—	C(Ph)=NOCH ₂ (2, 4, 6-Cl ₃ -Ph)	
73	CH ₃	—	C(Ph)=NOCH ₂ (2-CH ₃ -Ph)	
74	CH ₃	—	C(Ph)=NOCH ₂ (3-CH ₃ -Ph)	
75	CH ₃	—	C(Ph)=NOCH ₂ (4-CH ₃ -Ph)	
76	CH ₃	—	C(Ph)=NOCH ₂ (3-CH ₃ O-Ph)	
77	CH ₃	—	C(=N ⁺ CH ₃)-Ph ↓ O ⁻	m. p. 180.1 °C
78	CH ₃	—	C(=N ⁺ CH ₂ Ph)Ph ↓ O ⁻	m. p. 116.3 °C
79	CH ₃	—	C(Ph)=NNH ₂	m. p. 72.3°C
80	CH ₃	—	C(Ph)=NNHCOOC ₂ H ₅	
81	CH ₃	—	C(Ph)=NNHCSNHPh	
82	CH ₃	—	3-CN-Q ₂	m. p. 190-200 °C
83	CH ₃	—	Q ₄	
84	CH ₃	—	5-CH ₃ -5-i-C ₃ H ₇ -4-(=O)-Q ₄	m. p. 59°C
85	CH ₃	—	5-(CH ₃) ₂ -Q ₅	m. p. 114 °C
86	CH ₃	—	4-(CH ₃) ₂ -5-(=O)-Q ₆	m. p. 107 °C
87	CH ₃	—	4, 6-(CH ₃) ₂ -Q ₃	m. p. >180°C
88	CH ₃	—	4-CH ₃ -Q ₇	m. p. 89°C
89	CH ₃	—	4-t-C ₄ H ₉ -Q ₇	m. p. 61°C
90	CH ₃	—	4-(2-Cl-Ph)-Q ₇	m. p. 136 °C
91	CH ₃	—	4-(4-Cl-Ph)-Q ₇	m. p. 125 °C

第1表（続き）

No	R ¹	A	B	物性
92	CH ₃	—	4-(2,4-C1 ₂ -Ph)-Q ₇	m.p. 170 °C
93	CH ₃	—	4-(4-CH ₃ -Ph)-Q ₇	m.p. 118 °C
94	CH ₃	—	5-CH ₃ -4-Ph-Q ₇	m.p. 151 °C
95	CH ₃	—	4-CONHCH ₃ -Q ₇	m.p. 144 °C
96	CH ₃	—	4-CH ₂ COOH-Q ₇	m.p. 196 °C
97	CH ₃	—	4-CH ₂ CONH ₂ -Q ₇	m.p. 182 °C
98	CH ₃	—	4-CH ₂ COOC ₂ H ₅ -Q ₇	m.p. 98°C
99	CH ₃	—	4-CH ₂ CONHCH ₃ -Q ₇	m.p. 155 °C
100	CH ₃	—	4-CH ₂ CON(C ₂ H ₅) ₂ -Q ₇	m.p. 132 °C
101	CH ₃	—	5-Ph-Q ₈	m.p. 154 °C
102	CH ₃	—	5-SH-Q ₈	m.p. 182 °C
103	CH ₃	—	5-SCH ₃ -Q ₈	m.p. 65°C
104	CH ₃	CH ₂	Cl	nD 1.5590(26°C)
105	CH ₃	CH ₂	OH	nD 1.553(21 °C)
106	CH ₃	CH ₂	OCH ₃	nD 1.5180(26°C)
107	CH ₃	CH ₂	OC ₄ H ₉ -n	
108	CH ₃	CH ₂	OC ₈ H ₁₇ -n	
109	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ Ph	nD 1.5730(25°C)
110	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (2-C1-Ph)	
111	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (3-C1-Ph)	
112	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (4-C1-Ph)	
113	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (2-CH ₃ -Ph)	

第1表（続き）

No	R ¹	A	B	物性
114	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (3-CH ₃ -Ph)	
115	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (4-t-C ₄ H ₉ -Ph)	
116	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (4-CF ₃ -Ph)	
117	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (2, 4-(CH ₃) ₂ -Ph)	
118	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (3, 4-(CH ₃) ₂ -Ph)	
119	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (4-OH-Ph)	
120	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (4-CH ₃ O-Ph)	
121	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (4-CF ₃ O-Ph)	
122	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (2, 4-(CH ₃ O) ₂ -Ph)	
123	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (3, 4-(CH ₃ O) ₂ -Ph)	
124	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (4-NH ₂ -Ph)	
125	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (4-NO ₂ -Ph)	
126	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (4-COOCH ₃ -Ph)	
127	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (4-COOt-C ₄ H ₉ -Ph)	
128	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (4-CN-Ph)	
129	CH ₃	CH ₂	OCH ₂ (4-CH ₃ -Q ₁)	nD 1.547(26.3 °C)
130	CH ₃	CH ₂	OPh	
131	CH ₃	CH ₂	O(2-Cl-Ph)	
132	CH ₃	CH ₂	O(3-Cl-Ph)	
133	CH ₃	CH ₂	O(4-Cl-Ph)	
134	CH ₃	CH ₂	O(2-CH ₃ -Ph)	
135	CH ₃	CH ₂	O(3-CH ₃ -Ph)	

第1表 (続き)

No	R ¹	A	B	物性
136	CH ₃	CH ₂	O(4-t-C ₄ H ₉ -Ph)	
137	CH ₃	CH ₂	O(4-CF ₃ -Ph)	
138	CH ₃	CH ₂	O(2, 4-(CH ₃) ₂ -Ph)	
139	CH ₃	CH ₂	O(3, 4-(CH ₃) ₂ -Ph)	
140	CH ₃	CH ₂	O(4-OH-Ph)	
141	CH ₃	CH ₂	O(4-CH ₃ O-Ph)	
142	CH ₃	CH ₂	O(4-CF ₃ O-Ph)	
143	CH ₃	CH ₂	O(2, 4-(CH ₃ O) ₂ -Ph)	
144	CH ₃	CH ₂	O(3, 4-(CH ₃ O) ₂ -Ph)	
145	CH ₃	CH ₂	O(4-NH ₂ -Ph)	
146	CH ₃	CH ₂	O(4-NO ₂ -Ph)	
147	CH ₃	CH ₂	O(4-COOCH ₃ -Ph)	
148	CH ₃	CH ₂	O(4-COO-C ₄ H ₉ -t-Ph)	
149	CH ₃	CH ₂	O(4-CN-Ph)	
150	CH ₃	CH ₂	O-COCH ₃	nD 1.3580(25°C)
151	CH ₃	CH ₂	O-COC ₂ H ₅	
152	CH ₃	CH ₂	O-COC ₃ H ₇ -n	
153	CH ₃	CH ₂	O-COC ₃ H ₇ -i	
154	CH ₃	CH ₂	O-COC ₄ H ₉ -t	
155	CH ₃	CH ₂	O-COC ₄ H ₉ -s	
156	CH ₃	CH ₂	O-COC ₁₇ H ₃₅ -n	
157	CH ₃	CH ₂	O-COC ₆ H ₁₁ -cyclo	

第1表 (続き)

No	R ¹	A	B	物性
158	CH ₃	CH ₂	O-COCH=CH ₂	
159	CH ₃	CH ₂	O-COCH=CHPh	
160	CH ₃	CH ₂	O-COCH ₂ Cl	
161	CH ₃	CH ₂	O-COCF ₃	
162	CH ₃	CH ₂	O-COPh	m. p. 50-53 °C
163	CH ₃	CH ₂	O-CO(2-C ₁ -Ph)	
164	CH ₃	CH ₂	O-CO(3-C ₁ -Ph)	
165	CH ₃	CH ₂	O-CO(4-C ₁ -Ph)	
166	CH ₃	CH ₂	O-CO(2-CH ₃ -Ph)	
167	CH ₃	CH ₂	O-CO(3-CH ₃ -Ph)	
168	CH ₃	CH ₂	O-CO(4-t-C ₄ H ₉ -Ph)	
169	CH ₃	CH ₂	O-CO(4-CF ₃ -Ph)	
170	CH ₃	CH ₂	O-CO(2, 4-(CH ₃) ₂ -Ph)	
171	CH ₃	CH ₂	O-CO(3, 4-(CH ₃) ₂ -Ph)	
172	CH ₃	CH ₂	O-CO(4-CH ₃ O-Ph)	
173	CH ₃	CH ₂	O-CO(4-CF ₃ O-Ph)	
174	CH ₃	CH ₂	O-CO(2, 4-(CH ₃ O) ₂ -Ph)	
175	CH ₃	CH ₂	O-CO(3, 4-(CH ₃ O) ₂ -Ph)	
176	CH ₃	CH ₂	O-CO(4-NO ₂ -Ph)	
177	CH ₃	CH ₂	O-CO(4-COOCH ₃ -Ph)	
178	CH ₃	CH ₂	O-CO(4-COO C ₄ H ₉ -t-Ph)	
179	CH ₃	CH ₂	O-CO(4-CN-Ph)	

第1表（続き）

No	R ¹	A	B	物性
180	CH ₃	CH ₂	O-COOCH ₂ H ₅	nD 1.5041(26°C)
181	CH ₃	CH ₂	O-COOCH ₂ H ₉ -i	
182	CH ₃	CH ₂	ON=C(CH ₃) ₂	
183	CH ₃	CH ₂	ON=C(CH ₃)C ₂ H ₅	
184	CH ₃	CH ₂	ON=C ₆ H ₁₀ -cyclo	
185	CH ₃	CH ₂	ON=CHPh	
186	CH ₃	CH ₂	ON=CH(2-Cl-Ph)	
187	CH ₃	CH ₂	ON=CH(3-Cl-Ph)	
188	CH ₃	CH ₂	ON=CH(4-Cl-Ph)	
189	CH ₃	CH ₂	ON=CH(2-CH ₃ -Ph)	
190	CH ₃	CH ₂	ON=CH(3-CH ₃ -Ph)	
191	CH ₃	CH ₂	ON=CH(4-C ₄ H ₉ -t-Ph)	
192	CH ₃	CH ₂	ON=CH(4-CF ₃ -Ph)	
193	CH ₃	CH ₂	ON=CH(2, 4-(CH ₃) ₂ -Ph)	
194	CH ₃	CH ₂	ON=CH(3, 4-(CH ₃) ₂ -Ph)	
195	CH ₃	CH ₂	ON=CH(4-OH-Ph)	
196	CH ₃	CH ₂	ON=CH(4-CH ₃ O-Ph)	
197	CH ₃	CH ₂	ON=CH(4-CF ₃ O-Ph)	
198	CH ₃	CH ₂	ON=CH(2, 4-(CH ₃ O) ₂ -Ph)	
199	CH ₃	CH ₂	ON=CH(3, 4-(CH ₃ O) ₂ -Ph)	
200	CH ₃	CH ₂	ON=CH(4-NH ₂ -Ph)	
201	CH ₃	CH ₂	ON=CH(4-NO ₂ -Ph)	

第1表（続き）

No	R ¹	A	B	物性
202	CH ₃	CH ₂	ON=CH(4-COOCH ₃ -Ph)	
203	CH ₃	CH ₂	ON=C(CH ₃)Ph	
204	CH ₃	CH ₂	OSO ₂ CH ₃	
205	CH ₃	CH ₂	OSO ₂ CF ₃	
206	CH ₃	CH ₂	OSO ₂ Ph	
207	CH ₃	CH ₂	OSO ₂ (4-Br-Ph)	
208	CH ₃	CH ₂	OSO ₂ (4-CH ₃ -Ph)	ペースト
209	CH ₃	CH ₂	SPh	nD 1.636(24.6 °C)
210	CH ₃	CH ₂	SOPh	
211	CH ₃	CH ₂	SO ₂ Ph	m. p. 118 °C
212	CH ₃	CH ₂	SO ₂ (4-CH ₃ -Ph)	
213	CH ₃	CH ₂	SO ₂ (4-NO ₂ -Ph)	
214	CH ₃	CH ₂	SCH ₂ Ph	nD 1.612(24.6 °C)
215	CH ₃	CH ₂	SO ₂ CH ₂ Ph	m. p. 116 °C
216	CH ₃	CH ₂	SCON(CH ₂ CH=CH ₂) ₂	
217	CH ₃	CH ₂	SCO-Q ₉	
218	CH ₃	CH ₂	SCOOC ₂ H ₅	
219	CH ₃	CH ₂	SCSN(C ₂ H ₅) ₂	
220	CH ₃	CH ₂	NH ₂ · HCl	m. p. >250°C
221	CH ₃	CH ₂	N(C ₂ H ₅) ₂	ペースト
222	CH ₃	CH ₂	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂	ペースト
223	CH ₃	CH ₂	NHPh	

第1表(続き)

No	R ¹	A	B	物性
224	CH ₃	CH ₂	NH(4-CH ₃ -Ph)	
225	CH ₃	CH ₂	NHCOC ₃ H ₇ -n	
226	CH ₃	CH ₂	NHCOC ₂ H ₅	
227	CH ₃	CH ₂	NHCOC ₃ H ₇ -n	
228	CH ₃	CH ₂	NHCOC ₃ H ₇ -i	
229	CH ₃	CH ₂	NHCOC ₄ H ₉ -t	m. p. 93-94 °C
230	CH ₃	CH ₂	NHCOC ₄ H ₉ -s	
231	CH ₃	CH ₂	NHCOC ₁₇ H ₃₅ -n	
232	CH ₃	CH ₂	NHCOC ₃ H ₅ -cyclo	m. p. 75-78 °C
233	CH ₃	CH ₂	NHCO(2,2-Cl ₂ -C ₃ H ₅ -cyclo)	
234	CH ₃	CH ₂	NHCOC ₆ H ₁₁ -cyclo	
235	CH ₃	CH ₂	NHCOCH=CH ₂	
236	CH ₃	CH ₂	NHCOCH=CHPh	
237	CH ₃	CH ₂	NHCOCH ₂ Cl	
238	CH ₃	CH ₂	NHCOCF ₃	
239	CH ₃	CH ₂	NHCOPh	m. p. 96°C
240	CH ₃	CH ₂	NHCO(2-Cl-Ph)	
241	CH ₃	CH ₂	NHCO(3-Cl-Ph)	
242	CH ₃	CH ₂	NHCO(4-Cl-Ph)	
243	CH ₃	CH ₂	NHCO(2-CH ₃ -Ph)	
244	CH ₃	CH ₂	NHCO(3-CH ₃ -Ph)	
245	CH ₃	CH ₂	NHCO(4-t-C ₄ H ₉ -Ph)	

第1表 (続き)

No	R ¹	A	B	物性
246	CH ₃	CH ₂	NHC(3-CF ₃ -Ph)	
247	CH ₃	CH ₂	NHC(4-CF ₃ -Ph)	
248	CH ₃	CH ₂	NHC(2,4-(CH ₃) ₂ -Ph)	
249	CH ₃	CH ₂	NHC(3,4-(CH ₃) ₂ -Ph)	
250	CH ₃	CH ₂	NHC(4-OH-Ph)	
251	CH ₃	CH ₂	NHC(4-CH ₃ O-Ph)	
252	CH ₃	CH ₂	NHC(4-CF ₃ O-Ph)	
253	CH ₃	CH ₂	NHC(2,4-(CH ₃ O) ₂ -Ph)	
254	CH ₃	CH ₂	NHC(3,4-(CH ₃ O) ₂ -Ph)	
255	CH ₃	CH ₂	NHC(4-NH ₂ -Ph)	
256	CH ₃	CH ₂	NHC(4-NO ₂ -Ph)	
257	CH ₃	CH ₂	NHC(4-COOCH ₃ -Ph)	
258	CH ₃	CH ₂	NHC(2,4-Cl ₂ -Ph)	
259	CH ₃	CH ₂	NHC(3,4-Cl ₂ -Ph)	
260	CH ₃	CH ₂	N(CHO) ₂	m. p. 70-75 °C
261	CH ₃	CH ₂	Q ₁₀	
262	CH ₃	CH ₂	3,3,4,4,5,5-F ₆ -Q ₁₁	
263	CH ₃	CH ₂	Q ₁₂	m. p. 124-125 °C
264	CH ₃	CH ₂	NHC(OCOCH ₃) ₂	
265	CH ₃	CH ₂	NHC(OC ₂ H ₅) ₂	ペ-スト
266	CH ₃	CH ₂	NHC(OC ₄ H ₉) ₂ -i	
267	CH ₃	CH ₂	NHC(OC ₄ H ₉) ₂ -t	

第1表（続き）

No	R ¹	A	B	物性
268	CH ₃	CH ₂	NHC(=O)(4-NO ₂ -Ph)	
269	CH ₃	CH ₂	NHC(=O)OPh	
270	CH ₃	CH ₂	NHCONHCH ₃	
271	CH ₃	CH ₂	NHCONHCH ₂ H ₅	
272	CH ₃	CH ₂	NHCONHCH ₃ H ₇ -i	
273	CH ₃	CH ₂	NHCONHPh	m. p. 145 °C
274	CH ₃	CH ₂	NHCONH(2-Cl-Ph)	
275	CH ₃	CH ₂	NHCONH(3-Cl-Ph)	
276	CH ₃	CH ₂	NHCONH(4-Cl-Ph)	
277	CH ₃	CH ₂	NHCONH(2-CH ₃ -Ph)	
278	CH ₃	CH ₂	NHCONH(3-CH ₃ -Ph)	
279	CH ₃	CH ₂	NHCONH(4-t-C ₄ H ₉ -Ph)	
280	CH ₃	CH ₂	NHCONH(3-CF ₃ -Ph)	
281	CH ₃	CH ₂	NHCONH(4-CF ₃ -Ph)	
282	CH ₃	CH ₂	NHCONH(2, 4-(CH ₃) ₂ -Ph)	
283	CH ₃	CH ₂	NHCONH(3, 4-(CH ₃) ₂ -Ph)	
284	CH ₃	CH ₂	NHCONH(4-OH-Ph)	
285	CH ₃	CH ₂	NHCONH(3-CH ₃ O-Ph)	
286	CH ₃	CH ₂	NHCONH(4-i-C ₃ H ₇ O-Ph)	
287	CH ₃	CH ₂	NHCONH(4-CF ₃ O-Ph)	
288	CH ₃	CH ₂	NHCONH(2, 4-(CH ₃ O) ₂ -Ph)	
289	CH ₃	CH ₂	NHCONH(3, 4-(CH ₃ O) ₂ -Ph)	

第1表 (続き)

No	R ¹	A	B	物性
290	CH ₃	CH ₂	NHCONH(4-NH ₂ -Ph)	
291	CH ₃	CH ₂	NHCONH(4-NO ₂ -Ph)	
292	CH ₃	CH ₂	NHCONH(4-COOCH ₃ -Ph)	
293	CH ₃	CH ₂	NHCONH(2,4-Cl ₂ -Ph)	
294	CH ₃	CH ₂	NHCSNHCH ₃	
295	CH ₃	CH ₂	NHCSNHPH	m. p. 171-172 °C
296	CH ₃	CH ₂	NHC(=NCH ₃)OC ₂ H ₅	
297	CH ₃	CH ₂	NHC(=NPh)N(C ₂ H ₅) ₂	
298	CH ₃	CH ₂	NHC(=NPh)SCH ₃	
299	CH ₃	CH ₂	NHSO ₂ (4-CH ₃ -Ph)	ペ-スト
300	CH ₃	CH ₂	NHNH ₂	
301	CH ₃	CH ₂	NHN=C(CH ₃) ₂	
302	CH ₃	CH ₂	NHN=CHPh	
303	CH ₃	CH ₂	NHN=C(CH ₃)Ph	
304	CH ₃	CH ₂	Q ₁₋₃	
305	CH ₃	CH ₂	Q ₁₋₄	
306	CH ₃	CH ₂	Q ₁₋₅	
307	CH ₃	CH ₂	CHO	
308	CH ₃	CH ₂	CN	
309	CH ₃	CH ₂	COOCH ₃	
310	CH ₃	CH ₂	COOC ₂ H ₅	
311	CH ₃	CH ₂	COOC ₃ H _{7-i}	

第1表 (続き)

No	R ¹	A	B	物性
312	CH ₃	CH ₂	COOC ₈ H ₁₇ -n	
313	CH ₃	CH ₂	COOCH ₂ CH=CH ₂	
314	CH ₃	CH ₂	CONH ₂	
315	CH ₃	CH ₂	CONHCH ₃	
316	CH ₃	CH ₂	CONHC ₃ H ₇ -i	
317	CH ₃	CH ₂	CON(CH ₃) ₂	
318	CH ₃	CH ₂	CO-Q ₁₆	
319	CH ₃	CH ₂	CO-Q ₁₇	
320	CH ₃	CH ₂	CO-Q ₁₈	
321	CH ₃	CH ₂	CO-Q ₁₉	
322	CH ₃	CH ₂	CH(COCH ₃) ₂	
323	CH ₃	CH ₂	CH(COOCH ₂ H ₅) ₂	
324	CH ₃	CH ₂	C(NHCOCH ₃)(COOC ₂ H ₅) ₂	m. p. 93-97 °C
325	CH ₃	CH ₂	CH(SCH ₃)(SOCH ₃)	
326	CH ₃	CH ₂	Q ₂₀	
327	CH ₃	CHCl	COOCH ₃	nD 1.5456(23°C)
328	CH ₃	CHCH ₃	CN	
329	CH ₃	CHCH ₃	COOCH ₃	
330	CH ₃	C(CH ₃) ₂	CN	
331	CH ₃	C(CH ₃) ₂	COOCH ₃	
332	CH ₃	CHPh	C1	nD 1.5979(21.8°C)
333	CH ₃	CHPh	OH	m. p. 93.2°C

第1表（続き）

No	R ¹	A	B	物性
334	CH ₃	CHPh	OCH ₃	
335	CH ₃	CHPh	CN	
336	CH ₃	CHPh	COOH	
337	CH ₃	CH ₂ CH ₂	COOCH ₃	
338	CH ₃	CH=CH (E)	COOCH ₃	m. p. 70 °C
339	CH ₃	CH=CH (E)	CON(CH ₃) ₂	
340	CH ₃	CH=CH (E)	CONHPh	
341	CH ₃	CH=CH (Z)	COOCH ₃	m. p. 80-85°C
342	CH ₃	CH=CH (E, Z混合)	CHO	m. p. 77-78°C
343	CH ₃	C=C(SCH ₃) ₂	CN	
344	CH ₃	Q ₂ 1	CN	
345	CH ₃	C=C(COOCH ₃) ₂	H	
346	CH ₃	C=C(COOCH ₃)CN	H	ペースト
347	CH ₃	Q ₂ 2	CN	
348	C ₂ H ₅	CH ₂	C1	
349	C ₂ H ₅	CH ₂	OH	
350	C ₂ H ₅	CH ₂	OCH ₃	
351	C ₂ H ₅	CH ₂	OCH ₂ Ph	
352	C ₂ H ₅	CH ₂	OCH ₂ (4-C ₂ H ₅ -Q ₁)	
353	C ₃ H ₇ -i	CH ₂	F	
354	C ₃ H ₇ -i	CH ₂	C1	
355	C ₃ H ₇ -i	CH ₂	Br	

第1表（続き）

No	R ¹	A	B	物性
356	C ₃ H ₇ -i	CH ₂	I	
357	C ₃ H ₇ -i	CH ₂	OH	
358	C ₃ H ₇ -i	CH ₂	OCH ₃	
359	C ₃ H ₇ -i	CH ₂	OCH ₂ Ph	
360	C ₃ H ₇ -i	CH ₂	OCH ₂ (4-i-C ₃ H ₇ -Q ₁)	
361	C ₃ H ₇ -i	CH ₂	NH ₂ · HCl	
362	C ₃ H ₇ -i	CH ₂	N(CH ₃) ₂	
363	C ₃ H ₇ -i	CH ₂	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂	
364	C ₃ H ₇ -i	CH ₂	NHCOC ₃	
365	CH ₂ Cl	CH ₂	OH	ペ-スト
366	CF ₃	CH ₂	OH	
367	Ph	—	Q ₄	m. p. 150 °C
368	Ph	—	Q ₅	m. p. 158 °C
369	Ph	—	5-(CH ₃) ₂ -Q ₅	m. p. 147 °C
370	Ph	—	4-CH ₃ -Q ₇	m. p. 161 °C
371	Ph	—	4-t-C ₄ H ₉ -Q ₇	m. p. 110 °C
372	Ph	—	4-COOCH ₃ -Q ₇	m. p. 124 °C
373	Ph	—	4-CONHCH ₃ -Q ₇	m. p. 187 °C
374	Ph	—	4-CH ₂ COOH-Q ₇	m. p. 137 °C
375	Ph	—	4-CH ₂ CONH ₂ -Q ₇	m. p. 137 °C
376	Ph	—	4-CH ₂ CONHCH ₃ -Q ₇	m. p. 154 °C
377	Ph	—	5-CH ₃ -Q ₂₃	m. p. 85°C

第1表（続き）

No	R ¹	A	B	物性
378	Ph	CH ₂	Cl	
379	Ph	CH ₂	OH	
380	Ph	CH ₂	OCH ₃	
381	Ph	CH ₂	OCH ₂ Ph	
382	Ph	CH ₂	OCH ₂ (4-Ph-Q ₁)	
383	Ph	CH ₂	COOCH ₃	
384	Ph	CH ₂	CON(CH ₃)Ph	
385	Ph	CH ₂	CONH(4-CH ₃ O-Ph)	m. p. 129 °C
386	2-Cl-Ph	CH ₂	OH	
387	3-Cl-Ph	CH ₂	OH	
388	4-Cl-Ph	CH ₂	OH	
389	4-CH ₃ -Ph	CH ₂	OH	
390	3-CH ₃ -Ph	CH ₂	OH	
391	4-CH ₃ -Ph	CH ₂	OH	
392	4-t-C ₄ H ₉ -Ph	CH ₂	OH	
393	2-CF ₃ -Ph	CH ₂	OH	
394	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	OH	
395	2, 4-(CH ₃) ₂ -Ph	CH ₂	OH	
396	3, 4-(CH ₃) ₂ -Ph	CH ₂	OH	
397	4-OH-Ph	CH ₂	OH	
398	4-CH ₃ O-Ph	CH ₂	OH	
399	4-CF ₃ O-Ph	CH ₂	OH	

第1表 (続き)

No	R ¹	A	B	物性
400	4-PhO-Ph	CH ₂	OH	
401	2, 4-(CH ₃ O) ₂ -Ph	CH ₂	OH	
402	3, 4-(CH ₃ O) ₂ -Ph	CH ₂	OH	
403	4-COOCH ₃ -Ph	CH ₂	OH	
404	2, 4-Cl ₂ -Ph	CH ₂	OH	
405	3, 4-Cl ₂ -Ph	CH ₂	OH	
406	Q ₂ 4	CH ₂	OH	
407	Q ₂ 5	CH ₂	OH	
408	Q ₂ 6	CH ₂	OH	
409	Q ₂ 7	CH ₂	OH	m. p. 158 °C
410	Q ₂ 8	CH ₂	OH	
411	6-Cl-Q ₂ 7	CH ₂	OH	
412	Q ₂ 7	—	CN	m. p. 129 °C
413	4-F-Ph	CH ₂	O-CO-(4-Cl-Ph)	m. p. 79 °C
414	4-F-Ph	CH ₂	O-(4-CH ₃ O-Ph)	m. p. 86 °C
415	4-F-Ph	CH ₂	O-CO-CH ₂ -(4-CH ₃ -Ph)	m. p. 113 °C
416	4-F-Ph	CH ₂	O-CO-NH-Ph	m. p. 99 °C
417	4-F-Ph	CH ₂	ON=C(CH ₃)(4-Cl-Ph)	m. p. 91 °C
418	4-F-Ph	CH ₂	OH	m. p. 100 °C
419	4-F-Ph	CH ₂	Br	m. p. 88 °C
420	4-F-Ph	CH ₂	O-CO-CH ₃	m. p. 59 °C
421	Q ₂ 6	—	CN	m. p. 190 °C

第1表（続き）

No	R ¹	A	B	物性
422	Ph	CH ₂	CONH-(4-CH ₃ O-Ph)	m. p. 129 °C
423	Ph	—	C=NOH(NH ₂)	m. p. 130 °C
424	Ph	—	CN	
425	CH ₃	—	Q ₈	ペースト
426	CH ₃	—	5-CH ₃ -Q ₈	nD 1.5661(26.4°C)
427	CH ₃	—	SCH ₂ CH=CH ₂	ペースト
428	CH ₃	—	SCH ₂ C≡CH	ペースト
429	CH ₃	—	SCH ₂ -Ph	m. p. 89°C
430	CH ₃	—	SCH ₂ -(4-t-C ₄ H ₉ -Ph)	m. p. 79°C
431	CH ₃	—	S-C ₃ H ₇ -i	ペースト
432	CH ₃	—	S-CH ₂ -Q ₂ 7	m. p. 78°C
433	CH ₃	—	S-CH ₂ -Q ₂ 8	m. p. 97°C

第1表中、物性がペーストの化合物のH-NMR のデータを第2表に示す。

第2表

No	H-NMR [CDCl ₃ /TMS、δ 値(ppm)]
208	2.46(s, 3H), 2.63(s, 3H), 5.35(s, 2H), 7.35(d, 2H), 7.77(d, 2H).

第2表(続き)

No	H-NMR[CDCl ₃ /TMS、δ値(ppm)]
5 221	1.05(t, 6H), 2.54(q, 4H), 2.63(s, 3H), 3.78(s, 2H).
222	2.61(s, 3H), 3.10-3.12(m, 4H), 3.80(s, 2H), 5.16-5.24(m, 4H), 5.78-5.89(m, 2H).
265	1.25(t, 3H), 2.63(s, 3H), 4.15(q, 2H), 4.59(d, 2H), 5.2-5.35(br, 1H).
10 299	2.44(s, 3H), 2.58(s, 3H), 4.42(d, 2H), 5.37(br, t, 1H), 7.31(d, 2H), 7.70(d, 2H).
346	1.41(t, 3H), 2.90(s, 3H), 4.20(q, 2H), 8.34(s, 1H).
365	2.58(t, 1H), 5.03(s, 2H), 5.16(d, 2H).
426	3.08(s, 3H), 3.96(d, 2H), 5.27(d, 1H), 5.43(d, 1H), 6.00(m, 1H).
15 427	3.08(s, 3H), 5.23(d, 2H), 6.28(s, 1H).
430	1.55(d, 6H), 3.08(s, 3H), 4.02(m, 1H).

本発明の一般式(I)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体又はその塩
 20 類は農園芸用病害防除剤として有用であり、例えば稲いもち病(*Pyricularia oryzae*)、稲紋枯病(*Rhizoctonia solani*)、稲胡麻葉枯病(*Cochiobolus miyabeanus*)、大麦及び小麦等のうどんこ病(*Erysiphe graminis*)の如き種々の宿主植物についてのうどんこ病、エンバクの冠さび病(*Puccinia coronata*)及び他の植物のさび病、トマトの疫病(*Phytophthora infestans*)及び他の植物
 25 の疫病、キュウリのべと病(*Pseudoperonospora cubensis*)、ブドウのべと病(*Plasmopara viticola*)等の種々植物のべと病、リンゴ黒星病(*Venturia inaequalis*)、リンゴ斑点落葉病(*Alternaria mali*)、ナシ黒斑病(*Alternaria kikuchiana*)、カンキツ黒点病(*Diaporthe citri*)、シュードモナス種、例えばキュウリ斑点細菌病(*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*)、

トマト青枯病(*Pseudomonas solanacearum*)、キサントモナス種、例えばキャベツ黒腐病(*Xanthomonas campestris*)、イネ白葉枯病(*Xanthomonas oryzae*)、カンキツかいよう病(*Xanthomonas citri*)、エルウィニア種、例えばキャベツ軟腐病(*Erwinia carotovora*)等の細菌病、タバコモザイク病 (*Tobacco mosaic virus*)
5 等のウイルス病等の病害に対して極めて高い防除効果を有するものである。

本発明一般式(I)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体又はその塩類を有効成分とする農園芸用病害防除剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記病害に対して顕著な防除効果を有するものであるので、病害の発生が予測される時期に合わせて、病害の発生前又は発生
10 が確認された時点で水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の水田水、茎葉又は土壤に処理することにより本発明の農園芸用病害防除剤の所期の効果が奏せられるものである。

本発明の農園芸用病害防除剤は、農薬製剤上の常法に従い、使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。
15 即ち、本発明の一般式(I)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体又はその塩類はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させ、適宜の剤形、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、粒剤、粉剤、錠剤等に製剤して使用すれば良い。

20 本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、纖維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、粉碎合成樹脂等の合成重合体、粘土類（例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等）、タルク類（例えばタルク、ピロフィライド等）、シリカ類（例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン〔含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。〕）、活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉碎物、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウム、磷酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、硫安、磷安、硝安、尿素、塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以

上の混合物の形で使用される。

液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させうこととなるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは

- 5 単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類（例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等）、ケトン類（例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサン等）、エーテル類（例えばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等）、脂肪族炭化水素類（例えばケロシン、鉱油等）、芳香族炭化水素類（例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等）、ハロゲン化炭化水素類（例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、塩素化ベンゼン等）、エステル類（例えば酢酸エチル、ジイソブチルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等）、アミド類（例えばジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等）、ニトリル類（例えばアセトニトリル等）、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができる。

他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用

- 20 し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び／又は湿潤の目的のために界面活性剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、

- 25 ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エ斯特ル等の界面活性剤を例示することができる。

又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び／又は結合の目的のために、次に例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチ

ルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例え

5 ばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。

懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸塩等の補助剤を使用することもできる。

消泡剤としては、例えばシリコーン油等の補助剤を使用することもできる。

有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、例えば粉剤或

10 いは粒剤とする場合は0.01～50重量%、又乳剤或いは水和剤とする場合も同様0.01～50重量%が適当である。

本発明の農園芸用病害防除剤は各種病害を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害防除にに有効な量を当該病害の発生が予測される作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用すれば良く、

15 例えば水稻の病害防除の目的で本田への水面施用、稻育苗箱施用、湛水直播用種子粉衣等の施用方法、種子消毒法等で使用することができ、麦等の病害に対して茎、葉等へ散布する他に、土壤等に処理して根から吸収させて使用することもできる。

本発明の農園芸用病害防除剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象病害、

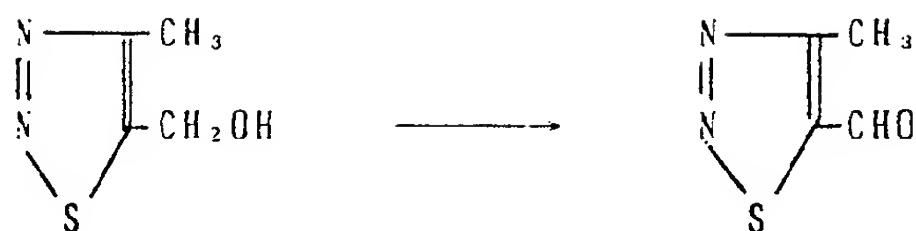
20 作物の生育状況、病害の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.1g～10kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

本発明の農園芸用病害防除剤を更に防除対象病害、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用病害防除剤と混合して使用することも可能である。

以下に本発明の一般式(I)で表される1, 2, 3-チアジアゾール誘導体又はその塩類の代表的な実施例、処方例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

実施例1. 4-メチル-1, 2, 3-チアジアゾール-5-カルバルデヒドの

製造（化合物No 7）



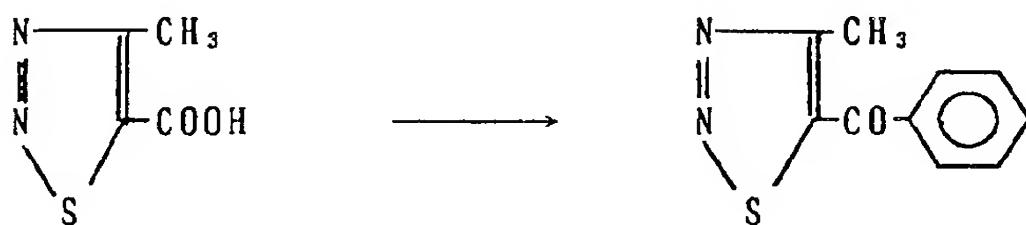
5

9. 9 g (4.6ミリモル) のクロロクロム酸ピリジニウム及び10 gのシリカゲルを25 mlの塩化メチレンに懸濁し、3.0 g (2.3ミリモル) の4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イルメタノールを加え、室温下に4時間攪拌し、反応を行った。反応終了後、反応液をエーテルで希釈し、フロリジルを濾過し、得られた濾液を減圧下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=3:1) で精製することにより目的物を2.0 g 得た。

物性：nD 1.5555 (26°C) 収率：62%

実施例2. 5-ベンゾイル-4-メチル-1,2,3-チアジアゾールの製造

15 (化合物No 9)

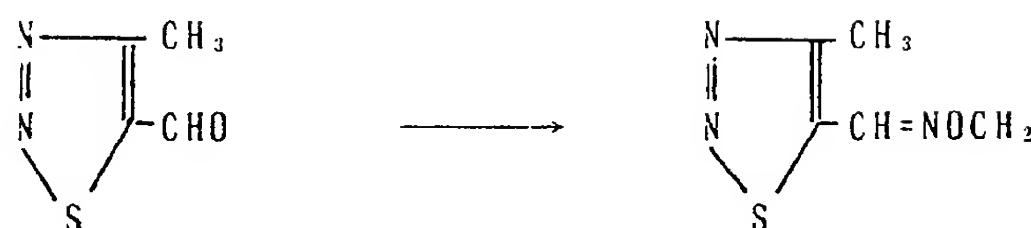


20 0.50 g (3.5ミリモル) の4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-カルボン酸を2.0 g (1.5ミリモル) の塩化チオニルに加え2時間加熱下に攪拌し、次いで減圧下に塩多チオニルを留去し、得られた残渣を塩化アルミニウム1.8 g (1.5ミリモル) 及びベンゼン20 mlの溶液に加え3時間加熱下に反応を行った。反応終了後、反応液を氷水中に注ぎ、目的物を酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄、次いで乾燥後、減圧下に溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=4:1) で精製することにより目的物を0.69 g 得た。

物性：nD 1.6145 (22°C) 収率：97%

実施例3. O-ベンジル-4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-カ

ルバルデヒドオキシムの製造（化合物No 2 1）

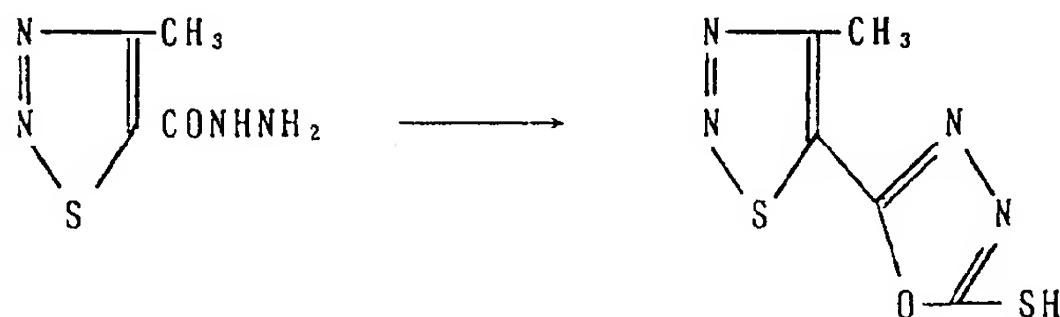


5

実施例 1 で得られた 4 - メチル - 1 , 2 , 3 - チアジアゾール - 5 - カルバルデヒド 0 . 4 0 g (3 . 1 ミリモル) 、 0 . 6 0 g (3 . 8 ミリモル) のベンジルオキシアミン塩酸塩及び 0 . 5 0 g (3 . 8 ミリモル) の酢酸ナトリウムを 1 0 m l のエタノールに加えて 4 時間加熱還流下に反応を行った。反応終了後、反応液に酢酸エチルを加えて濾過し、沈殿物を除いた後、減圧下に濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n - ヘキサン : 酢酸エチル = 4 : 1) で精製することにより目的物を 0 . 6 6 g 得た。

物性 : n D 1 . 5 9 9 8 (2 5 °C) 収率 : 9 1 %

実施例 4 . 5 - (5 - メルカプト - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル) - 4 - メチル - 1 , 2 , 3 - チアジアゾールの製造（化合物No 1 0 2）

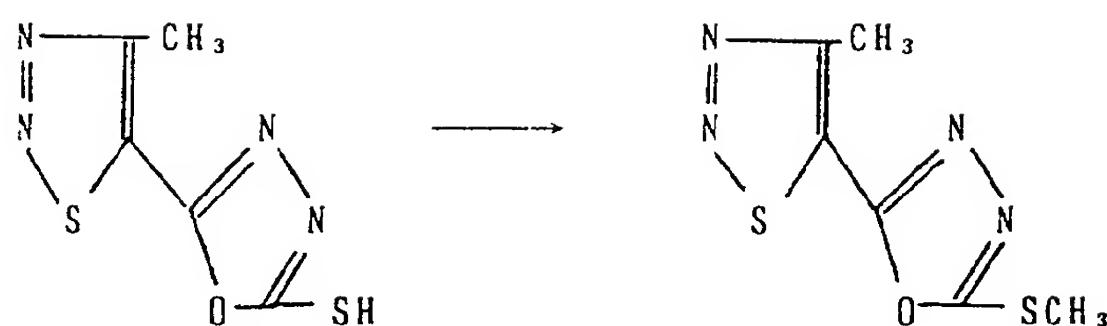


20

1 . 1 g (7 . 2 ミリモル) の 4 - メチル - 1 , 2 , 3 - チアジアゾール - 5 - カルボヒドラジドを 1 5 m l のエタノールに溶解し、 0 . 3 g の水酸化カリウムの 1 m l 水溶液を加え、次いで 0 . 6 m l の二硫化炭素を加えて 6 . 5 時間加熱還流下に反応を行った。反応終了後、減圧下に溶媒を留去し、水を加えて酢酸で酸性とし、析出する結晶を濾集することにより目的物 0 . 8 2 g を得た。

物性 : m . p . 1 8 2 °C 収率 : 5 9 %

実施例 5 . 4 - メチル - 5 - (5 - メチルチオ - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル) - 1 , 2 , 3 - チアジアゾールの製造（化合物No 1 0 3 ）

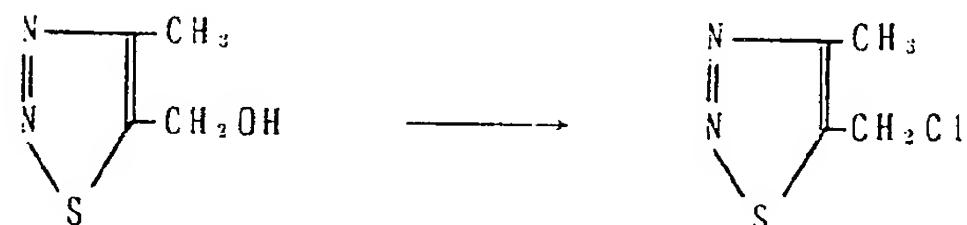


0. 40 g (2. 0 ミリモル) の 5 - (5 - メルカプト - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 4 - メチル - 1, 2, 3 - チアジアゾール、0. 43 g (3. 0 ミリモル) の ヨウ化メチル、0. 83 g (6. 0 ミリモル) の 炭酸カリウムを 10 ml の アセトン中に 加え、5 時間 加熱還流下に 反応を行った。反応終了後、沈殿物を 濾去し、濾液を 減圧下に 濃縮して 得られた 残渣を シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n - ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) で 精製することにより 目的物を 0. 41 g 得た。

物性: m. p. 65 °C

収率: 96 %

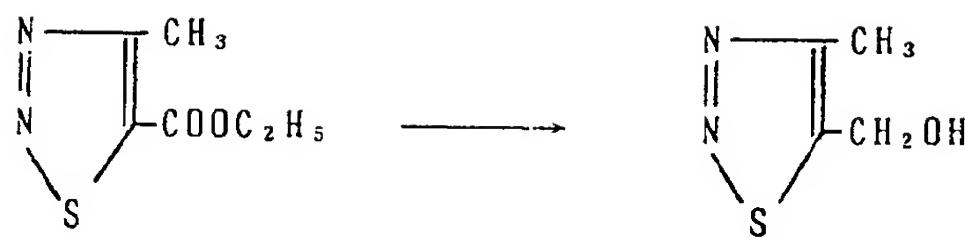
実施例 6. 5 - クロロメチル - 4 - メチル - 1, 2, 3 - チアジアゾールの製造 (化合物No 1 0 4)



氷冷下に 0. 50 g (3. 8 ミリモル) の 4 - メチル - 1, 2, 3 - チアジアゾール - 5 - イルメタノールに 2 ml の 塩化チオニルを 加え、室温下に 2 時間攪拌して 反応を行った。次いで、反応液に 水を 加えて 反応を 停止し、酢酸エチルで 目的物を 抽出し、水洗及び乾燥後、減圧下に 溶媒を 留去し、得られた 残渣を シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n - ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) で 精製することにより 目的物を 0. 46 g 得た。

物性: nD 1. 5590 (26 °C) 収率: 81 %

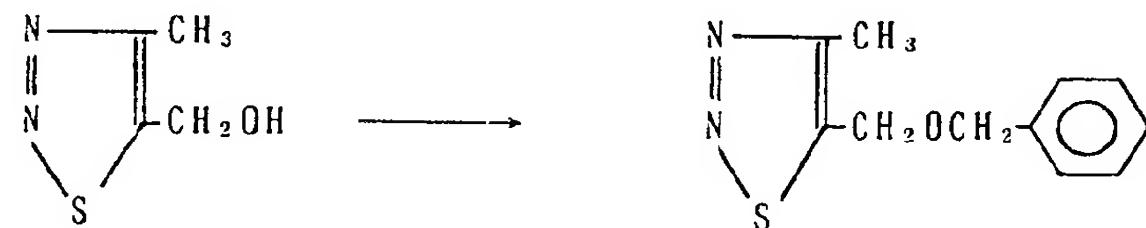
実施例 7. 4 - メチル - 1, 2, 3 - チアジアゾール - 5 - イルメタノールの 製造 (化合物No 1 0 5)



5 0. 10 g (2. 5 ミリモル) の水酸化ナトリウムを 10 ml のエタノールに溶解し、1. 0 g (5. 8 ミリモル) の 4-メチル-1, 2, 3-チアジアゾール-5-カルボン酸エチルを加え、次いで 0. 33 g (8. 7 ミリモル) の水素化ホウ素ナトリウムを加えて室温下に反応を行った。反応終了後、反応液に水を加えて過剰の水素化ホウ素ナトリウムを分解した後、酢酸エチルで目的物を抽出
10 し、水洗及び乾燥後、減圧下に溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) で精製することにより目的物を 0. 36 g 得た。

物性: nD 1. 553 (21°C) 収率: 48%

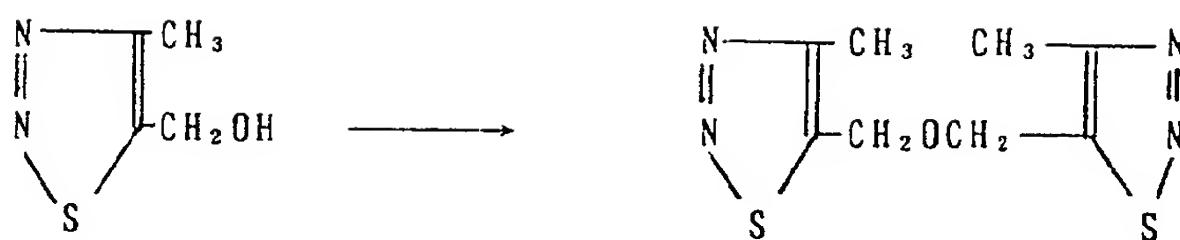
実施例 8. 4-メチル-5-ベンジルオキシメチル-1, 2, 3-チアジアゾールの製造 (化合物No 109)



20 0. 40 g (3. 1 ミリモル) の 4-メチル-1, 2, 3-チアジアゾール-5-イルメタノールを 10 ml のアセトンに溶解し、1. 6 g (1.2 ミリモル) の炭酸カリウム及び 0. 80 g (4. 5 ミリモル) のベンジルブロミドを加えて 10 時間加熱還流下に反応を行った。反応終了後、沈殿物を濾去し、減圧下に溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) で精製することにより目的物を 0. 65 g 得た。

物性: nD 1. 5730 (25°C) 収率: 96%

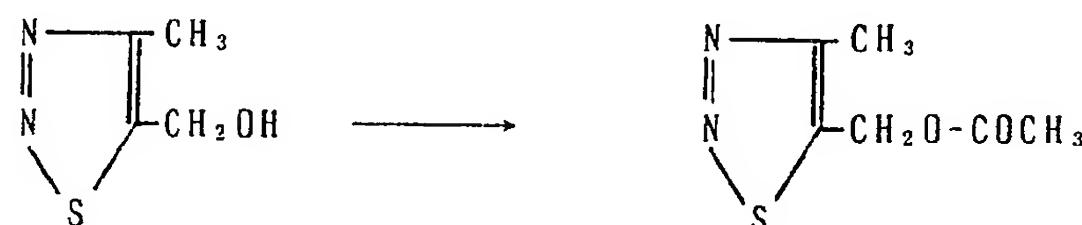
実施例 9. 4, 4' -ジメチル-5, 5' -オキシビス (メチル-1, 2, 3-チアジアゾール) の製造 (化合物No 129)



5 2.0 g (1.5ミリモル) の4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イルメタノール及び3.9 g (3.9ミリモル) のトリエチルアミンを20 mlのテトラヒドロフランに溶解し、氷冷下に3.5 g (1.8ミリモル) のトシリクロリドを加え、室温下に1日反応を行った。次いで反応液に飽和食塩水を加えて反応を停止し、目的物を酢酸エチルで抽出し、抽出液を希塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水の順で洗浄し、減圧下に溶媒を濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=4:1) で精製することにより目的物を1.1 g 得た。

物性: nD 1.547 (26°C) 収率: 57%

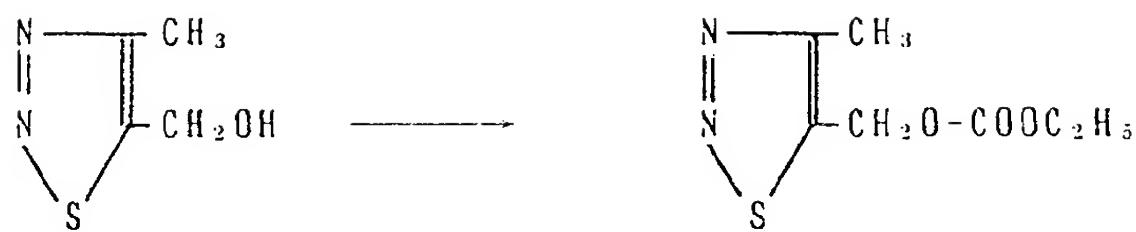
実施例10. 4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イルメチル アセテートの製造 (化合物No 150)



20 0.50 g (3.8ミリモル) の4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イルメタノール、0.50 g (5.7ミリモル) のアセチルクロリド及び0.80 g (7.6ミリモル) のトリエチルアミンを10 mlのテトラヒドロフランに溶解し、室温下に18時間反応を行った。次いで反応液に飽和食塩水を加えて反応を停止し、目的物を酢酸エチルで抽出し、水洗及び乾燥後、減圧下に溶媒を濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=3:1) で精製することにより目的物を0.70 g 得た。

物性: nD 1.3580 (25°C) 収率: 100%

実施例11. エチル 4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イルメチル カーボネートの製造 (化合物No 180)

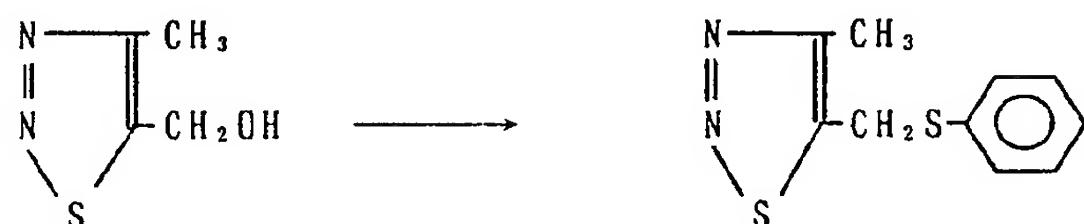


5 0.50 g (3.8ミリモル) の4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イルメタノールを5mlのテトラヒドロフランに溶解し、0.80 g (7.6ミリモル) のトリエチルアミン及び0.60 g (5.7ミリモル) のクロロ炭酸エチルを加え、室温下に22時間反応を行った。次いで反応液に水を加えて反応を停止し、目的物を酢酸エチルで抽出し、水洗及び乾燥後、減圧下に溶媒を濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=5:1) で精製することにより目的物を0.50 g 得た。

物性: nD 1.5041 (26°C) 収率: 68%

実施例12. 4-メチル-5-フェニルチオメチル-1,2,3-チアジアゾールの製造 (化合物No 209)

15



0.50 g (3.8ミリモル) の4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イルメタノールに氷冷下、3mlの塩化チオニルを加えて4時間反応を行い、次いで減圧下に濃縮し、該濃縮液に1.30 g (11.5ミリモル) の炭酸カリウム、0.38 g (3.4ミリモル) のチオフェノール及び10mlのアセトンを加えて7時間加熱還流下に反応を行った。反応終了後、反応液を室温まで冷却し、沈殿物を濾去した後、減圧下に溶媒を濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=5:1) で精製することにより目的物を0.64 g 得た。

物性: nD 1.636 (25°C) 収率: 85%

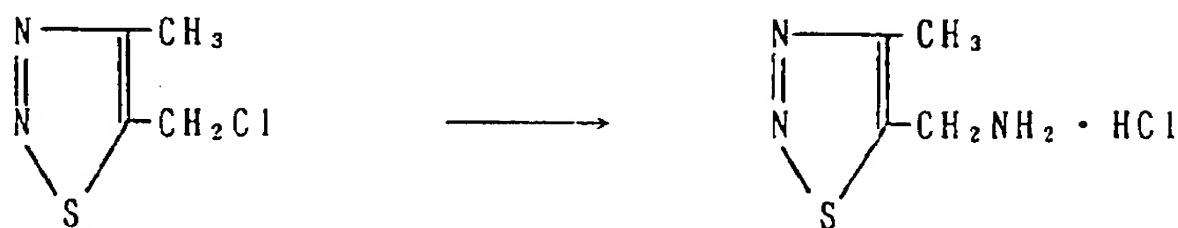
実施例13. 4-メチル-5-フェニルスルホニルメチル-1,2,3-チアジアゾールの製造 (化合物No 211)



5 0.20 g (0.99ミリモル) の4-メチル-5-フェニルチオメチル-1,2,3-チアジアゾールを5.0 mlの塩化メチレンに溶解し、該溶液に0.40 g (2.3ミリモル) のメタクロロ過安息香酸を加えて20時間室温下に反応を行った。次いで反応液に亜硫酸水素ナトリウム水溶液を加えて反応を停止し、目的物を酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄後、10 減圧下に溶媒を濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=2:1) で精製することにより目的物を0.23 g 得た。

物性：m.p. 118°C 収率：100%

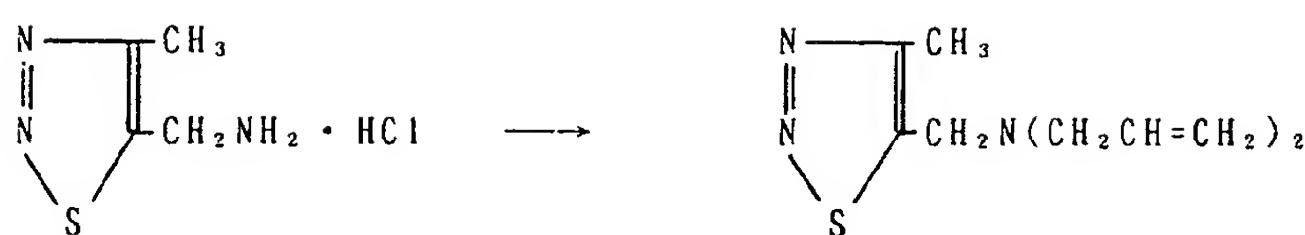
実施例14. 5-アミノメチル-4-メチル-1,2,3-チアジアゾール塩
15 酸塩の製造（化合物No 220）



20 7.0 g (4.7ミリモル) の5-クロロメチル-4-メチル-1,2,3-チアジアゾール及び9.0 g (9.4ミリモル) のホルムイミドナトリウムを5.0 mlのアセトニトリルに加え、16時間加熱還流下に反応を行った。反応終了後、反応液を室温まで冷却し、飽和食塩水を加えて目的物を酢酸エチルで抽出し、水洗及び乾燥ご、減圧下に溶媒を濃縮した。次いで、得られた結晶に4.0 mlの水を加えて攪拌下に3.0 mlの濃塩酸を加えた。10分後に減圧下で水と塩酸を留去し、残渣を酢酸エチルで洗浄することにより目的物を6.6 g 得た。

物性：m.p. > 250°C 収率：77%

実施例15. 5-(N,N-ジアリルアミノ)メチル-4-メチル-1,2,3-チアジアゾールの製造（化合物No 222）



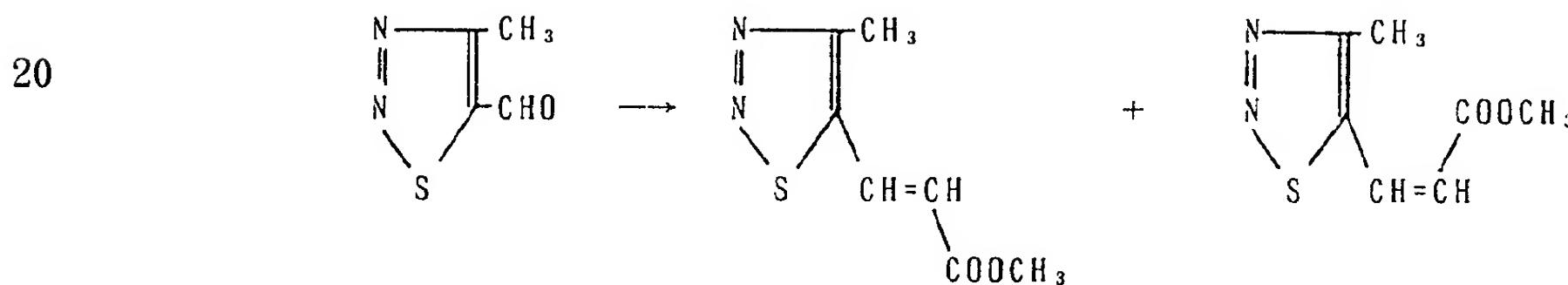
5 0.50 g (3.0ミリモル) の 5-アミノメチル-4-メチル-1, 2, 3-チアジアゾール塩酸塩、1.10 g (9.0ミリモル) の臭化アリル及び2.1 g (15ミリモル) の炭酸カリウムを 15 ml のアセトンに加え、20時間加熱還流下に反応を行った。反応終了後、反応液を濾過して沈殿物を除き、減圧下に溶媒を濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) で精製することにより目的物を 0.42 g 得た。

物性 : ペースト状物 収率 : 67%

H-NMR [CDCl₃/TMS、δ値(ppm)]

2.61(s. 3H), 3.10-3.12(m. 4H), 3.80(s. 2H), 5.16-5.24(m. 4H),
5.78-5.89(m. 2H).

15 実施例 1 6. (E)-3-(4-メチル-1, 2, 3-チアジアゾール-5-イル)-2-プロペン酸メチル (化合物No 3 3 8) 及び (Z)-3-(4-メチル-1, 2, 3-チアジアゾール-5-イル)-2-プロペン酸メチル (化合物No 3 4 1) の製造



0.40 g (3.1ミリモル) の 4-メチル-1, 2, 3-チアジアゾール-5-カルバルデヒドをテトラヒドロフランに溶解し、該溶液に 1.1 g (3.4ミリモル) のトリフェニルホスホラニリデン酢酸メチルを加え、16時間室温下に反応を行った。反応終了後、反応液を室温まで冷却し、飽和食塩水を加えて目的物を酢酸エチルで抽出し、水洗及び乾燥後、減圧下に溶媒を濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 5 :

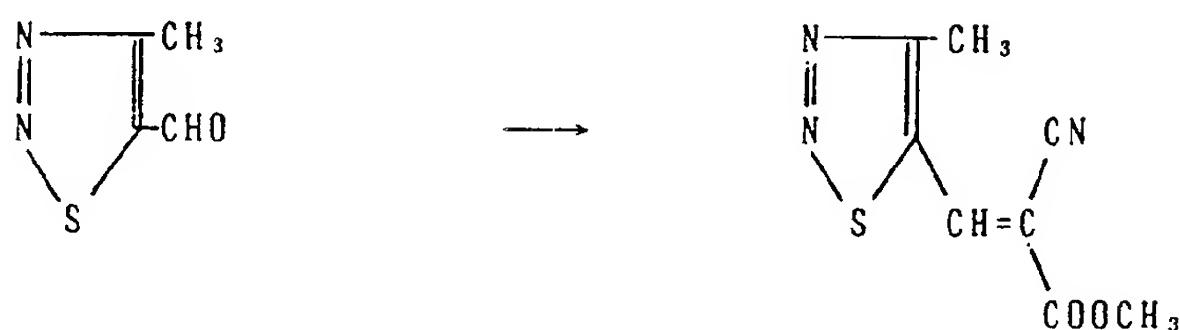
1) で精製することにより目的物であるE-体を0.49g、Z-体を0.05g得た。

物性：E-体 m. p. 70°C 収率：90%

Z-体 m. p. 80-85°C 収率：10%

5 実施例17. 2-シアノ-3-(4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イル)-2-プロペン酸エチルの製造（化合物No 3 4 6）

10



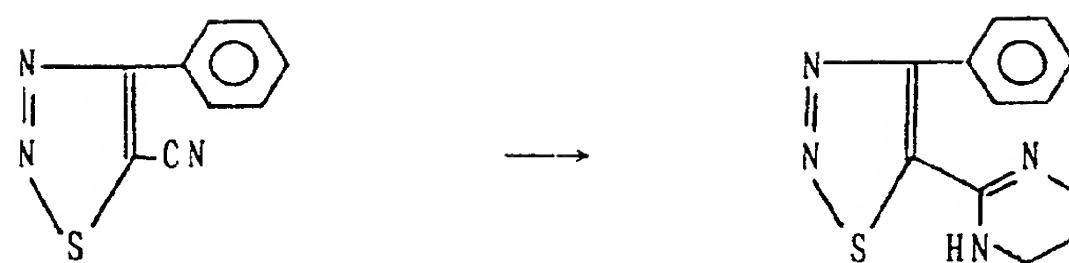
1. 5 g (1.2ミリモル) の4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-カルバルデヒド、1.5 g (1.3ミリモル) のシアノ酢酸エチル、0.40 g (6.0ミリモル) のピロリジン及び0.20 g (1.2ミリモル) のトシリ酸を50mlのトルエンに加え、Dean-Stark脱水装置を備えた反応容器で2時間加熱還流下に反応を行った。反応終了後、反応液に飽和食塩水を加えて目的物を酢酸エチルで抽出し、有機層を希塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水の順で洗浄し、減圧下に溶媒を濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=3:1) で精製することにより目的物を0.73g得た。

物性：ペースト状物 収率：30%

H-NMR [CDCl₃/TMS、δ値(ppm)]

1.41(t, 3H), 2.90(s, 3H), 4.20(q, 2H), 8.34(s, 1H).

実施例18. 4-フェニル-3,4,5,6-テトラヒドロピリミジン-2-イル-1,2,3-チアジアゾールの製造（化合物No 3 6 8）

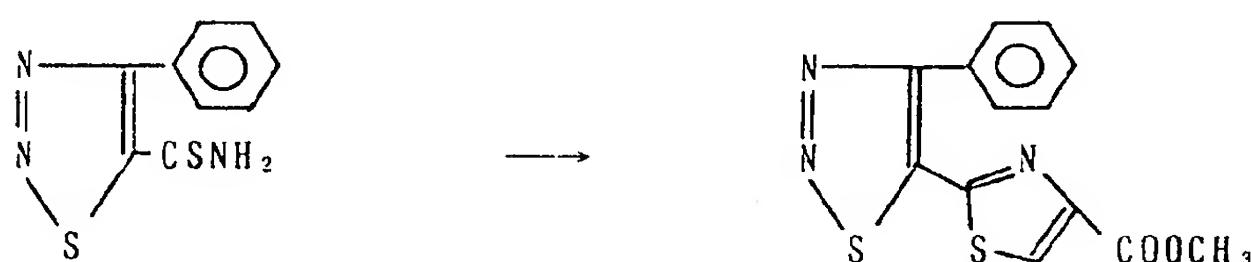


5 0.95 g (5.0ミリモル) の4-フェニル-1,2,3-チアジアゾール-5-カルボニトリル及び3.8 g (5.0ミリモル) の1,3-プロパンジアミンを10m1のエタノールに溶解し、0.05 g のナトリウムエトキシドを加えて8時間加熱還流下に反応を行った。反応終了後、反応液を室温まで冷却し、溶媒を減圧下に留去し、目的物を酢酸エチルで抽出した。有機層を減圧下に濃縮し、得られた油状物を少量の酢酸エチルで再結晶することにより目的物を0.68 g 得た。

物性：m. p. 158°C 収率：55%

実施例19. 2-(4-フェニル-1,2,3-チアジアゾール-5-イル)チアジアゾール-4-カルボン酸メチルの製造（化合物No 372）

15



1 1.1 g (5.0ミリモル) の4-フェニル-1,2,3-チアジアゾール-5-カルボチオアミド及び0.92 g (5.0ミリモル) のプロモピルビン酸メチルを20m1のクロロベンゼンに溶解し、3時間加熱還流下に反応を行った。反応終了後、反応液を室温まで冷却し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて目的物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を減圧下に溶媒を濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=3:1) で精製することにより目的物を0.74 g 得た。

物性：n. p. 124°C 収率：41%

以下に本発明の代表的な実施例及び試験例を示す。

尚、処方例中、部とあるのは重量部を示す。

処方例1

第1表記載の化合物 50部

キシレン 40部

ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと
アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物 10部

5 以上を均一に混合溶解して乳剤とする。

処方例2

第1表記載の化合物 3部

クレー粉末 82部

珪藻土粉末 15部

10 以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

処方例3

第1表記載の化合物 5部

ベントナイトとクレーの混合粉末 90部

リグニンスルホン酸カルシウム 5部

15 以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。

処方例4

第1表記載の化合物 20部

カオリיןと合成高分散珪酸 75部

ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルとアル

20 キルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物 5部

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

試験例1. 水面施用によるイネいもち病防除試験

1／10000アールのポットで栽培した水稻（5～6葉期）に第1表記載の化合物を有効成分とする薬剤を有効成分として200g／10aの割合で水面施用し、温室内に1週間放置した後、イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) の胞子懸濁液を噴霧接種した。

接種後、温室に1日放置した後、温室に移し、接種6日間置いて十分に発病させた後、各葉の病斑数を調査し、無処理区と比較して防除価を算出し、下記の基準に従って判定を行った。

A : 防除価 100~95%

B : 防除価 94~85%

C : 防除価 84~60%

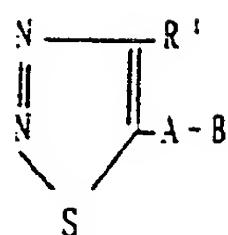
D : 防除価 59~0%

- 5 上記の試験の結果、第1表に記載の化合物優れたいもち病防除活性を示し、7、
17~19、21、24、35、36、60、62、66~69、77、83、
84、87~89、91、93~100、102、104~106、109、1
29、150、162、180、209、220~222、229、239、2
60、263、273、295、299、327、338、341、342、3
10 46、365、367、369、371、376はC以上の判定であり、特に化
合物7、37、88、89、91、104、105、109、129、150、
220、221、222、239、260、263、273、299、327、
342、367、371はAの防除効果を示すものである。

請求の範囲

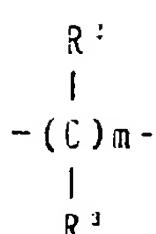
1. 一般式(I)

5



(I)

(式中、R¹ は水素原子、C₁-C₈ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、
10 C₁-C₄ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、ハロC₁-C₄ アルコキシ基又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基
を有する置換フェニル基、同一又は異なっても良く、1～3個の酸素原子、窒素
原子又は硫黄原子を有する5～6員ヘテロ環、又は同一若しくは異なっても良く、
ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、メルカプト基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ ア
ルコキシ基、C₁-C₄ アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシル基、カルボキ
シ C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基、C₁-C₄ アルコキシカルボ
ニルC₁-C₄ アルキル基、アミノ基、同一又は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄
アルキル基又はフェニル基より選択される置換基を有する置換アミノ基、カルバ
モイル基、同一又は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄ アルキル基又はフェニル
20 基より選択される置換基を有する置換カルバモイル基、カルバモイルC₁-C₄ アル
キル基又は同一若しくは異なっても良く、1～2個のC₁-C₄ アルキル基又はフェ
ニル基より選択される置換基を有する置換カルバモイルC₁-C₄ アルキル基から選
択される1～4個の置換基を有し、同一又は異なっても良く、1～3個の酸素原
子、窒素原子、又は硫黄原子を有する置換5～6員ヘテロ環を示し、Aは
25



(式中、R²及びR³は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シア

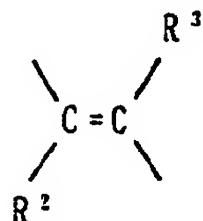
ノ基、ホルミル基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、C₁-C₄ アルキルチオ基、C₁-C₄ アルキルスルフィニル基、C₁-C₄ アルキルスルホニル基、C₁-C₄ アルキルカルボニル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄ アルキル基、
5 ハロC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、ハロC₁-C₄ アルコキシ基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニル基、フェニルカルボニル基、又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、C₁-C₄ アルキル基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を環上に有する置換フェニルカルボニル基を示し、
10 R²及びR³は一緒になって-O-、-S(0)n-（式中、nは0～2の整数を示す。）、-CO-又は

-NR⁸-

（式中、R⁸は水素原子、ホルミル基、C₁-C₈ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、C₂-C₄ アルケニル基、ハロC₂-C₄ アルケニル基、C₂-C₄ アルキニル基、ハロC₂-C₄ アルキニル基、C₁-C₄ アルキルチオ基、C₁-C₄ アルキルスルフィニル基、C₁-C₄ アルキルスルホニル基、C₁-C₄ アルキルカルボニル基、カルバモイル基、同一又は異なっても良く、C₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換カルバモイル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニル基、フェニルC₁-C₄ アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5
20 個の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₄ アルキル基、フェニルカルボニル基、又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5
25 個の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₄ アルキル基、フェニルカルボニル基、又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を環上に有する置換フェニルカルボニル基を示す。）
で示される基で中断されても良いC₂-C₆ アルキレン基により3～7員環を形成す

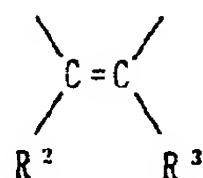
ることもでき、該3～7員環は1以上の一又は異なっても良いハロゲン原子又はC₁-C₄アルキル基から選択される置換基を有することもできる。mは0～4の整数を示す。)、

5



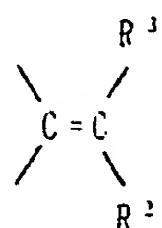
(式中、R²及びR³は前記に同じ。)、

10



(式中、R²及びR³は前記に同じ。)、

15 又は

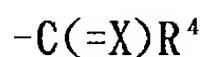


20 (式中、R²及びR³は前記に同じ。)

を示し、BはAの定義中、mが0の場合、シアノ基、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子、又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロ環、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、メルカプト基、C₁-C₄アルキル基、C₁-C₄アルコキシ基、C₁-C₄アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシリ基、カルボキシ C₁-C₄アルキル基、C₁-C₄アルコキシカルボニル基、C₁-C₄アルコキシカルボニルC₁-C₄アルキル基、アミノ基、同一又は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄アルキル基又はフェニル基により置換されたアミノ基、カルバモイル基、同一又は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄アルキル基又はフェニル基により置換されたカルバモイル基、カルバモイ

ルC₁-C₄ アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、1～2個のC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基により置換されたカルバモイルC₁-C₄ アルキル基から選択される1～4個の置換基を有し、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子、又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する置換5～6員ヘテロ

5 環、又は



(式中、R⁴ は水素原子、C₁-C₈ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、C₂-C₄

- 10 アルケニル基、ハロC₂-C₄ アルケニル基、C₂-C₄ アルキニル基、ハロC₂-C₄ アルキニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニル基、フェニルC₁-C₄ アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニルC₁-C₄ アルキル基、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロ環、又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、メルカプト基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、C₁-C₄ アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシリ基、カルボキシC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニルC₁-C₄ アルキル基、アミノ基、同一又は異なっても良く、C₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換アミノ基、カルバモイル基、同一又は異なっても良く、C₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換カルバモイル基、カルバモイルC₁-C₄ アルキル基、又は同一若しくは異なっても良く、C₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換カルバモイルC₁-C₄ アルキル基から選択される1～4個の置換基を有し、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する置換5～6員ヘテロ

環を示す。

XはO、S、

N-R⁶

5 (式中、R⁶は後記に示す。)、

NO-R⁶

(式中、R⁶は後記に示す。)、

10 N(→O)-R⁶

(式中、R⁶は後記に示す。)、

NN(R⁶)R⁷

(式中、R⁶及びR⁷は後記に示す。)又は

15

NN=C(R⁶)R⁷

(式中、R⁶及びR⁷は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、ホルミル基、C₁-C₄アルキル基、C₂-C₄アルケニル基、C₂-C₄アルキニル基、C₁-C₄アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₄アルキルスルホニル基、C₁-C₂アルキルカルボニル基、C₁-C₄アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄アルキル基、ハロC₁-C₄アルキル基、C₁-C₄アルコキシ基、ハロC₁-C₄アルコキシ基、アミノ基又はC₁-C₄アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換
20 フェニル基、フェニルC₁-C₄アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄アルキル基、ハロC₁-C₄アルキル基、C₁-C₄アルコキシ基、ハロC₁-C₄アルコキシ基、アミノ基又はC₁-C₄アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換
25 フェニル基、フェニルC₁-C₄アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄アルキル基、ハロC₁-C₄アルキル基、C₁-C₄アルコキシ基、ハロC₁-C₄アルコキシ基、アミノ基又はC₁-C₄アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₄アルキル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原

子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、ハロC₁-C₄ アルコキシ基又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、カルバモイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、C₁-C₄ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基又はハロC₁-C₄ アルコキシ基から選択される1～5個の置換基を環上に有する置換フェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換カルバモイル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、チオカルバモイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基により置換されたチオカルバモイル基、C₁-C₄ アルコキシカーボンイミドイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を窒素原子上に有するC₁-C₄ アルコキシカーボンイミドイル基、C₁-C₄ アルキルチオカーボンイミドイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を窒素原子上に有するC₁-C₄ アルキルスルフィニルカーボンイミドイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を窒素原子上に有するC₁-C₄ アルキルスルフィニルカーボンイミドイル基、C₁-C₄ アルキルスルホニルカーボンイミドイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を窒素原子上に有するC₁-C₄ アルキルスルホニルカーボンイミドイル基、アミジノ基、同一又は異なっても良く、C₁-C₆ アルキル基又はフェニル基により置換されたアミジノ基、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロ環、又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、メルカプト基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、C₁-C₄ アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシル基、カルボキシC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニルC₁-C₄ アルキル基、アミノ基、同一又は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄

アルキル基又はフェニル基により置換されたアミノ基、カルバモイル基、同一又は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄アルキル基又はフェニル基により置換されたカルバモイル基、カルバモイルC₁-C₄アルキル基、又は同一若しくは異なっても良く、1～2個のC₁-C₄アルキル基又はフェニル基により置換されたカルバモイ
5 イルC₁-C₄アルキル基から選択される1～4個の置換基を有し、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する置換5～6員ヘテロ環を示し、R⁶及びR⁷は一緒になって-O-、-S(O)n-（式中、nは前記に同じ。）、-CO-又は

10 -N(R⁸)-

（式中、R⁸は前記に同じ。）

で示される基で中断されても良いC₂-C₆アルキレン基により3～7員環を形成することもでき、該3～7員環は1以上の同一又は異なっても良いハロゲン原子又
15 はC₁-C₄アルキル基から選択される置換基を有することもできる。）を示す。）を示す。

mが1以上の場合、Bは水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、同一又は異なっても良い、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロ環、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、
20 シアノ基、メルカプト基、C₁-C₄アルキル基、C₁-C₄アルコキシ基、C₁-C₄アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシル基、カルボキシC₁-C₄アルキル基、C₁-C₄アルコキシカルボニル基、C₁-C₄アルコキシカルボニルC₁-C₄アルキル基、アミノ基、カルバモイル基、同一又は異なっても良い1～2個のC₁-C₄アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を有する置換カルバモイル基、カルバモ
25 イルC₁-C₄アルキル基、又は同一若しくは異なっても良い1～2個のC₁-C₄アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を有する置換カルバモイルC₁-C₄アルキル基から選択される1～3個の置換基を有し、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する置換5～6員ヘテロ環、

$-C(=X)R^5$

(式中、Xは前記に同じくし、 R^5 は水素原子、 C_1-C_8 アルキル基、ハロ C_1
 $-C_4$ アルキル基、 C_2-C_4 アルケニル基、ハロ C_2-C_4 アルケニル基、 C_2-C_4 アルキ
5 ニル基、ハロ C_2-C_4 アルキニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロ
ゲン原子、シアノ基、水酸基、 C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ基又は C_1
 $-C_4$ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェ
ニル基、フェニル C_1-C_4 アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、
シアノ基、水酸基、 C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ基又は C_1-C_4 アルコキ
10 シカルボニル基から選択される1～5個の置換基を環上に有する置換フェニル C_1
 $-C_4$ アルキル基、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子か
ら選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロ環、同一又は異なっ
ても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、メルカプト基、 C_1-C_4 アルキル基、
 C_1-C_4 アルコキシ基、 C_1-C_4 アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシル基、
15 カルボキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_4 アルコキ
シカルボニル C_1-C_4 アルキル基、アミノ基、同一又は異なっても良く、 C_1-C_4 アルキル基又はフェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換アミノ基、
カルバモイル基、同一又は異なっても良く、 C_1-C_4 アルキル基又はフェニル基か
ら選択される1～2個の置換基を有する置換カルバモイル基、カルバモイル C_1
20 $-C_4$ アルキル基、又は同一若しくは異なっても良く、 C_1-C_4 アルキル基又はフェ
ニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換カルバモイル C_1-C_4 アルキ
ル基から選択される1～4個の置換基を有し、同一又は異なっても良く、酸素原
子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する置換
5 ～6員ヘテロ環、

25

$O-R^6$

(式中、 R^6 は前記に同じ。)、

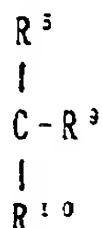
$S(O)n-R^6$

(式中、n 及び R⁶ は前記に同じ。) 又は

N(R⁶)R⁷

(式中、R⁶ 及び R⁷ は前記に同じ。) を示す。) 、

5



(式中、R⁵ は前記に同じくし、R⁹ 及び R¹⁰ は同一又と異なっても良く、ホ
10 ルミル基、C₁-C₄ アルキルカルボニル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基、フェ
ニルカルボニル基、又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、
水酸基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボ
ニル基から選択される 1 ~ 5 個の置換基を環上に有する置換フェニルカルボニル
基を示し、R⁹ 及び R¹⁰ が一緒になって-0-、-S(0)n- (式中、n は前記に
15 同じ。) 、-CO- 又は

-N(R⁸)-

(式中、R⁸ は前記に同じ。)

で示される基で中断されても良いC₂-C₆ アルキレン基により 3 ~ 7 員環を形成す
20 ることもでき、該 3 ~ 7 員環は 1 以上の同一又は異なっても良いハロゲン原子又
はC₁-C₄ アルキル基から選択される置換基を有することもできる。) 、

O-R⁶

(式中、R⁶ は前記に同じ。) 、

25

S(0)n-R⁶

(式中、R⁶ 及び n は前記に同じ。) 、

N(R⁶)R⁷

(式中、R⁶ 及びR⁷ は前記に同じ。)、



(式中、R⁶ 及びR⁷ は前記に同じ。) 又は

5

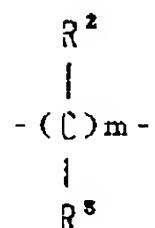


(式中、R⁶ 及びR⁷ は前記に同じ。)

を示す。]

で表される 1, 2, 3-チアジアゾール誘導体又はその塩類。

10 2. R¹ は水素原子、C₁-C₈ アルキル基、又はハロC₁-C₄ アルキル基を示し、Aは



15

(式中、R²及びR³は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ホルミル基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、C₁-C₄ アルキルチオ基、C₁-C₄ アルキルスルフィニル基、C₁-C₄ アルキルスルホニル基、C₁-C₄ アルキルカルボニル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、ハロC₁-C₄ アルコキシ基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される 1 ~ 5 個の置換基を有する置換フェニル基、フェニルカルボニル基、又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、C₁-C₄ アルキル基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される 1 ~ 5 個の置換基を環上に有する置換フェニルカルボニル基を示し、mは0 ~ 4 の整数を示す。) を示す。

BはAの定義中、mが0の場合、シアノ基、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子、又は硫黄原子から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 5 ~

6員ヘテロ環、同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、メルカプト基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、C₁-C₄ アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシル基、カルボキシ C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基、C₁-C₄ アルコキカルボニル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニルC₁-C₄ アルキル基、アミノ基、同一又は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基により置換されたアミノ基、カルバモイル基、同一又は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基により置換されたカルバモイル基、カルバモイルC₁-C₄ アルキル基、同一又は異なっても良く、1～2個のC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基により置換されたカルバモイルC₁-C₄ アルキル基から選択される1～4個の置換基を有し、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子、又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する置換5～6員ヘテロ環、又は

-C(=X)R⁴

15 (式中、R⁴ は水素原子、C₁-C₈ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニル基、又は同一若しくは異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する
20 5～6員ヘテロ環を示し、XはO、S、

NO-R⁶

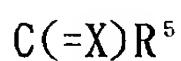
(式中、R⁶ は後記に示す。)、

25 NN(R⁶)R⁷
(式中、R⁶ 及びR⁷ は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、ホルミル基、C₁-C₄ アルキル基、C₂-C₄ アルケニル基、C₂-C₄ アルキニル基、C₁-C₄ アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₄ アルキルスルホニル基、C₁-C₂₀ アルキルカルボニル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なって

も良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、ハロC₁-C₄ アルコキシ基、アミノ基又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニル基、フェニルC₁-C₄ アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、ハロC₁-C₄ アルコキシ基、アミノ基又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₄ アルキル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、ハロC₁-C₄ アルコキシ基又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、カルバモイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、C₁-C₄ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基又はハロC₁-C₄ アルコキシ基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニル基から選択される1～2個の置換基を有する置換カルバモイル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、チオカルバモイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基により置換されたチオカルバモイル基、C₁-C₄ アルコキシカーボンイミドイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を窒素原子上に有するC₁-C₄ アルコキシカーボンイミドイル基、C₁-C₄ アルキルチオカーボンイミドイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を窒素原子上に有するC₁-C₄ アルキルチオカーボンイミドイル基、C₁-C₄ アルキルスルフィニルカーボンイミドイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を窒素原子上に有するC₁-C₄ アルキルスルフィニルカーボンイミドイル基、C₁-C₄ アルキルスルホニルカーボンイミドイル基、同一又は異なっても良いC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を窒素原子上に有するC₁

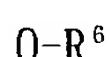
-C₁ アルキルスルホニルカーボンイミドイル基、アミジノ基、同一又は異なっても良いC₁-C₆ アルキル基又はフェニル基により置換されたアミジノ基、又は同一若しくは異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロ環を示す。) を示す。) を示す。

- 5 mが1以上の場合、Bは水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、同一又は異なっても良い、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロ環、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、メルカプト基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、C₁-C₄ アルキルチオ基、カルボニル基、カルボキシル基、カルボキシC₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニル基、C₁-C₄ アルコキシカルボニルC₁-C₄ アルキル基、アミノ基、カルバモイル基、同一又は異なっても良い1～2個のC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を有する置換カルバモイル基、カルバモイルC₁-C₄ アルキル基、又は同一若しくは異なっても良い1～2個のC₁-C₄ アルキル基又はフェニル基から選択される置換基を有する置換カルバモイルC₁-C₄ アルキル基から選択される1～3個の置換基を有し、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する置換5～6員ヘテロ環、



20

- (式中、Xは前記に同じくし、R⁵は水素原子、C₁-C₈ アルキル基、ハロC₁-C₄ アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C₁-C₄ アルキル基、C₁-C₄ アルコキシ基、又はC₁-C₄ アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニル基、同一又は異なっても良く、酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロ環、



(式中、R⁶は前記に同じ。)、

$S(0)n-R^6$

(式中、n 及び R^6 は前記に同じ。) 又は

$N(R^6)R^7$

(式中、 R^6 及び R^7 は前記に同じ。) を示す。) 、

5

$O-R^6$

(式中、 R^6 は前記に同じ。) 、

$S(0)n-R^6$

10 (式中、n 及び R^6 は前記に同じ。) 、

$N(R^6)R^7$

(式中、 R^6 及び R^7 は前記に同じ。) 、

15 $N=C(R^6)R^7$

(式中、 R^6 及び R^7 は前記に同じ。) 又は

$ON=C(R^6)R^7$

(式中、 R^6 及び R^7 は前記に同じ。)

20 で表される請求項 1 記載の 1, 2, 3 -チアジアゾール誘導体又はその塩類。

3. 請求項 1 記載の 1, 2, 3 -チアジアゾール誘導体又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用病害防除剤。

4. 請求項 2 記載の 1, 2, 3 -チアジアゾール誘導体又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用病害防除剤。

25 5. 請求項 3 記載の農園芸用病害防除剤を植物病害の発生が好ましくない植物に対して、その有効量を処理することを特徴とする農園芸用病害防除剤を処理することを特徴とする植物病害の防除方法。

6. 請求項 4 記載の農園芸用病害防除剤を植物病害の発生が好ましくない植物に対して、その有効量を処理することを特徴とする農園芸用病害防除剤を処理す

ることを特徴とする植物病害の防除方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP97/03467

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl⁶ C07D285/06, C07D417/04, A01N43/82

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl⁶ C07D285/00-285/14, A01N43/00-92

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAS (STN), REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP, 7-252242, A2 (Sagami Chemical Research Center, Dainippon Ink & Chemicals, Inc.), October 3, 1995 (03. 10. 95) (Family: none)	1 - 6
PA	WO, 96/29871, A2 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), October 3, 1996 (03. 10. 96) & AU, 9650159, A & JP, 8-325110, A	1 - 6
PA	WO, 97/12863, A1 (Shionogi & Co., Ltd.), April 10, 1997 (10. 04. 97) & AU, 9670950, A	1 - 6
PA	JP, 9-249665, A2 (Sagami Chemical Research Center, Dainippon Ink & Chemicals, Inc.), September 22, 1997 (22. 09. 97) (Family: none)	1 - 6
A	WO, 95/01340, A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), January 12, 1995 (12. 01. 95) & JP, 7-304748, A & EP, 707000, A1	1 - 6

 Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

December 22, 1997 (22. 12. 97)

Date of mailing of the international search report

January 13, 1998 (13. 01. 98)

Name and mailing address of the ISA/

Japanese Patent Office

Facsimile No.

Authorized officer

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP97/03467

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO, 95/07278, A1 (Du Pont de Nemours, E.I., and Co.), March 16, 1995 (16. 03. 95) & AU, 9475518, A	1 - 6
A	EP, 280275, A2 (Mitsubishi Chemical Corp.), August 31, 1988 (31. 08. 88) & BR, 8800876, A & JP, 63-258858, A & JP, 2-000175, A & US, 4914097, A & US, 4956375, A & DE, 3870478, G & CA, 1304380, C & ES, 2030777, T3	1 - 6
A	JP, 70-27573, B (Takeda Chemical Industries, Ltd.), September 9, 1970 (09. 09. 70) (Family: none)	1 - 6

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP97/03467

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))
Int. CL. 6 C07D285/06, C07D417/04, A01N43/82

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))
Int. CL. 6 C07D285/00-285/14, A01N43/00-92

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)
CAS(STN), REGISTRY(STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	JP, 7-252242, A2 (財団法人相模中央化学研究所、大日本インキ化学工業株式会社) 3. 10月. 1995 (03. 10. 95) ファミリーなし	1-6
PA	WO, 96/29871, A2 (日本農薬株式会社) 3. 10月. 1996 (03. 10. 96) &AU, 9650159, A &JP, 8-325110, A	1-6
PA	WO, 97/12863, A1 (塩野義製薬株式会社) 10. 4月. 1997 (10. 04. 97) &AU, 9670950, A	1-6

C欄の続きにも文献が列挙されている。

パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
 「E」先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの
 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
 「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

22. 12. 97

国際調査報告の発送日

13.01.98

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100

東京都千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号

特許庁審査官 (権限のある職員)

齋藤 恵



4 C 9737

電話番号 03-3581-1101 内線 6850

C(続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
PA	JP, 9-249665, A2 (財団法人相模中央化学研究所、大日本インキ化学工業株式会社) 22.9月. 1997 (22.09.97) ファミリーなし	1-6
A	WO, 95/01340, A1 (日産化学工業株式会社) 12.1月. 1995 (12.01.95) &JP, 7-304748, A &EP, 707000, A1,	1-6
A	WO, 95/07278, A1 (DU PONT DE NEMOURS, E. I., AND CO.) 16.3月. 1995 (16.03.95) &AU, 9475518, A	1-6
A	EP, 280275, A2 (三菱化成株式会社) 31.8月. 1988 (31.08.88) &BR, 8800876, A &JP, 63-258858, A &JP, 2-000175, A &US, 4914097, A &US, 4956375, A &DE, 3870478, G &CA, 1304380, C &ES, 2030777, T3	1-6
A	JP, 70-27573, B (武田薬品工業株式会社) 9.9月. 1970 (09.09.70) ファミリーなし	1-6